

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2003 年 11 月 27 日 (27.11.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/097598 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07D 209/14,
209/94, 209/86, 209/88, 401/04, 403/04, 409/12, 409/14,
471/04, 209/16, 403/06, 401/06, 401/14, 487/04, 231/56,
495/04, A61K 31/403, 31/405, 31/4439, 31/454, 31/437,
31/4709, 31/407, A61P 11/06, 37/08, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP03/06076

(22) 国際出願日: 2003 年 5 月 15 日 (15.05.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2002-142126 2002 年 5 月 16 日 (16.05.2002) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 塩野
義製薬株式会社 (SHIONOGI & CO., LTD.) [JP/JP]; 〒
541-0045 大阪府 大阪市中央区 道修町 3 丁目 1 番 8 号
Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 谷本 憲彦 (TAN-
IMOTO, Norihiko) [JP/JP]; 〒553-0002 大阪府 大阪市
福島区 鷺洲 5 丁目 1 2 番 4 号 塩野義製薬株式会
社内 Osaka (JP). 平松 義春 (HIRAMATSU, Yoshiharu)
[JP/JP]; 〒553-0002 大阪府 大阪市福島区 鷺洲 5 丁目
1 2 番 4 号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 光森
進 (MITSUMORI, Susumu) [JP/JP]; 〒553-0002 大阪府
大阪市福島区 鷺洲 5 丁目 1 2 番 4 号 塩野義製薬株

式会社内 Osaka (JP). 稲垣 雅尚 (INAGAKI, Masanao)
[JP/JP]; 〒553-0002 大阪府 大阪市福島区 鷺洲 5 丁目
1 2 番 4 号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 山内 秀晃, 外 (YAMAUCHI, Hideaki et al.);
〒553-0002 大阪府 大阪市福島区 鷺洲 5 丁目 1 2 番
4 号 塩野義製薬株式会社 知的財産部 Osaka (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO,
NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL,
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU,
ZA, ZM, ZW.

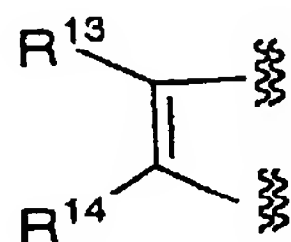
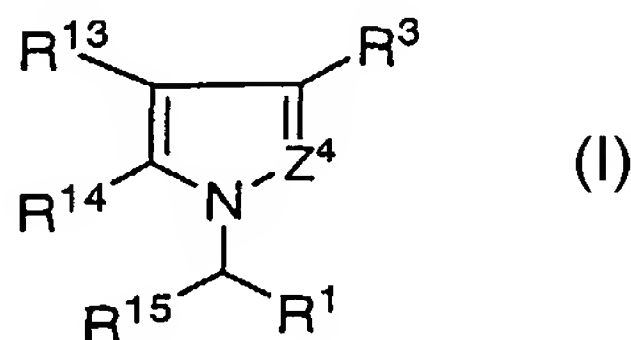
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM,
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許
(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,
GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),
OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

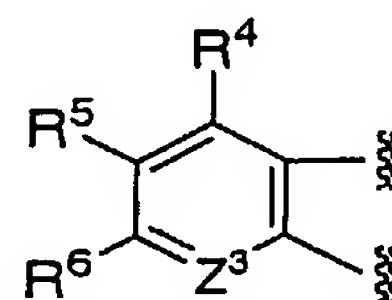
2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: COMPOUND EXHIBITING PGD 2 RECEPTOR ANTAGONISM

(54) 発明の名称: P G D 2 受容体拮抗作用を有する化合物



(a)



(b)

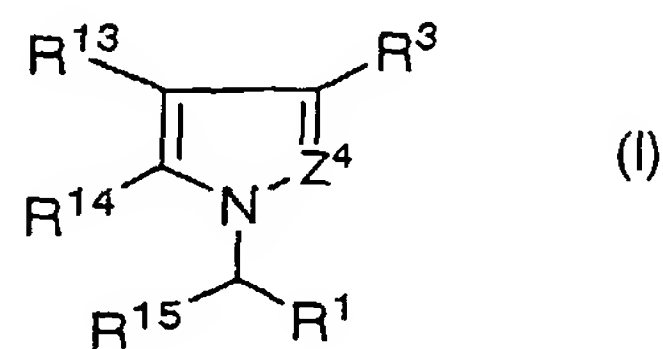
(57) Abstract: A compound exhibiting CRTH 2 receptor antagonism, represented by the following formula (I), which compound is useful in the treatment of allergosis with which the association of eosinocytes is presumed, etc.: (I) wherein the group represented by the formula: (a) is a group of the formula: (b) or the like; R¹ represents carboxyl, etc.; R³ represents a group of the formula -(CH₂)_n-N(-Y)SO₂-Ar, etc.; and the other substituents are as defined in claim 1.

[続葉有]



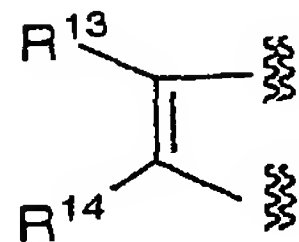
(57) 要約:

C R T H 2 受容体拮抗作用を有する下記式 (I) で表される新規化合物を見出した。該化合物は好酸球が関与していると考えられるアレルギー疾患等に有用である。



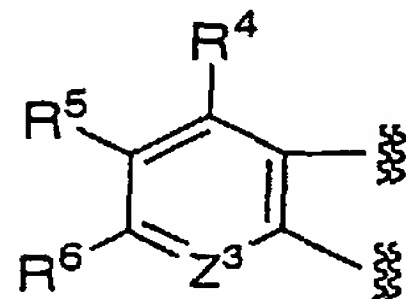
(式中、

式：



で示される基は

式：



等を、 R^1 は、カルボキシ等を、 R^3 は

式： $-(CH_2)_n-N(-Y)SO_2-Ar$ 等を

その他の置換基は請求の範囲 1 に記載された通りを示す。)

明細書

P G D₂ 受容体拮抗作用を有する化合物

5 技術分野

本発明は、C R T H₂ 受容体拮抗作用を有する新規化合物に関する。

背景技術

10 プロスタグランジンD₂ (P G D₂) は、アラキドン酸からP G G₂、P G H₂ を経て産生される代謝産物であり、種々の強力な生理作用を有していることが知られている。例えば、中枢神経系においては睡眠、ホルモン分泌などに関与し、末梢においては血小板凝集阻害作用、気管支平滑筋の収縮、血管の拡張または収縮などに関与していることが知られている (Pharmacol. Rev. (1994) 46, 205-229)。さらに、P G D₂ は肥満細胞から産生される主要なアラキドン酸代謝産物
15 であり、強力な気管支収縮作用、血管透過性の亢進や好酸球などの炎症細胞の遊走を惹起する事から、気管支喘息などのアレルギー性疾患の病態形成に深く関与していると考えられている。

P G D₂ の受容体としては、従来D P 受容体のみが知られており、その受容体拮抗剤がW O 98/25915 号、W O 01/66520 号、W O 01/79169 等に記載されている。

20 しかし、D P 受容体の選択的作動薬であるB W-2 4 5 Cは、P G D₂ による好酸球浸潤作用などを再現できないことから、P G D₂ にはD P 受容体とは別の受容体が存在することが以前より示唆されていた (J. Immunol. (1992) 148, 3536-3542; Invest. Ophthalmol. Vis. Sci. (1990) 31, 138-146、Br. J. Pharmacol. (1985) 85, 367-375; J. Pharmacol. Exp. Ther. (1995) 275, 611-617等)。最近になり、C R T H₂ 受容体がP G D₂ の第2 の受容体であり、P G D₂ はこの受容体
25 を介して好酸球、好塩基球の遊走を惹起することが報告された (J. Exp. Med. (2001) 193, 255-261)。

本発明化合物に類似した構造を有するトロンボキサン A_2 (TXA $_2$) 受容体拮抗剤および血小板凝集抑制剤が特開昭 61-249960、特開昭 62-198659、特開昭 62-249969、特開平 2-193965、特開平 3-151360、特開平 4-230363、特開平 4-234846、特開平 4-257578、特開平 8-157471、特開平 8-245587、DE3909600、Eur. J. Med. Chem., (1991) 26(8), 821-827 に記載されているが、PGD $_2$ 拮抗活性については全く記載されていない。

3-(4-クロロフェニルスルホニルアミノ)-9-(2-カルボキシメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロカルバゾールおよびそのエチルエステルが、TXA $_2$ 拮抗作用およびTXA $_2$ 合成酵素阻害作用を有することが特開平 3-151360 に開示されているが、具体的な活性値は記載されていない。

3-(4-クロロフェニルスルホニルアミノエチル)インドール-1-アセティックアシッドおよび3-(4-クロロフェニルスルホニルアミノプロピル)インドール-1-アセティックアシッドが、TXA $_2$ /PGH $_2$ 受容体拮抗作用を有することがEur. J. Med. Chem., 1991, 26(8), 821-827 に記載されている。

また3-(4-フルオロフェニルスルホンアミド)-1,2,3,4-テトラヒドロ-9-カルバゾールプロピオン酸が、アレルギー性皮膚炎、遅延型アレルギー反応を介する皮膚炎、および乾癬の治療剤として有用であることが特開平 7-175991、WO97/44031、特開平 11-106337、および特開平 11-116477 に、ケモカイン産生抑制作用を有することが特開平 11-322600 に記載されている。さらに、該化合物がPGD $_2$ 誘発気管支収縮に対し抑制効果を示すことから、DP受容体を介してPGD $_2$ 拮抗作用を有する可能性のあることがJ. Allergy Clin. Immunol. (1992) 89, 1119-1126 に記載されている。しかし、現在では、1) PGD $_2$ が高濃度域 (1 μ M 以上) においてトロンボキサン受容体にも結合すること (Eur. J. Pharmacol. (1992) 226, 149-156; Br. J. Pharmacol. (1991) 103, 1883-1888 etc.)、2) DP受容体に対する親和性の弱い他のトロンボキサン受容体拮抗化合物も同様の抑制作用を示すこと (Int. Arch. Allergy Immunol. 1992, 98, 239-246)、3) 選択的DP受容体拮抗化合物はPGD $_2$ 誘発気管支収縮を抑制しないこと (Br. J. Pharmacol.

(1989) 96, 291-300) が知られており、上記の抑制作用はトロンボキサン受容体を介した反応を抑制したものであり、該化合物が直接的な D P 受容体拮抗作用を有するものではないと考えられている (Br. J. Pharmacol. (1989) 96, 291-300)。

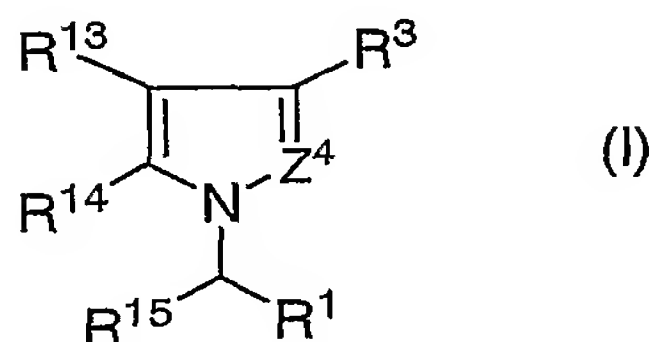
また、D P 受容体と比較して選択的に C R T H 2 受容体に結合する 4 種の化合物が EP 1170594 に開示されている。しかし、本発明化合物とは構造が非類似であり、結合活性等の詳細についても記載されていない。

発明の開示

本発明者らは、T X A₂ 受容体拮抗作用を有さない選択的な C R T H 2 受容体拮抗作用を有する新規化合物を見出した。

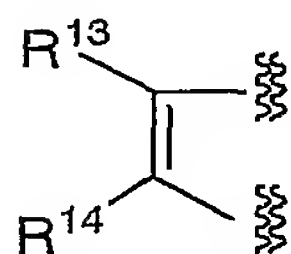
すなわち、本発明は、

I) 式 (I) :

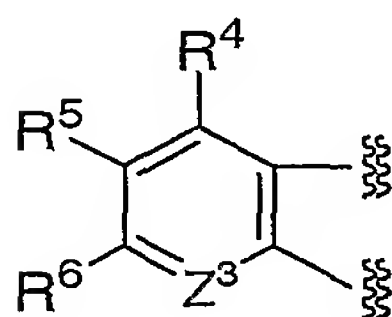


(式中、

式 :

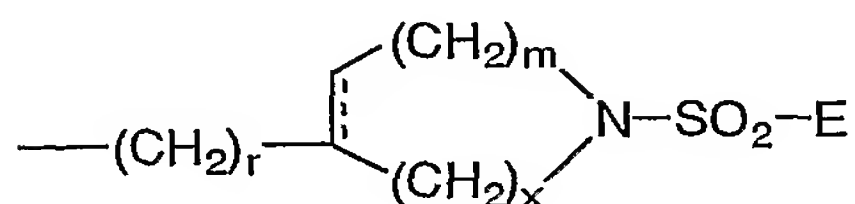


で示される基は式 :

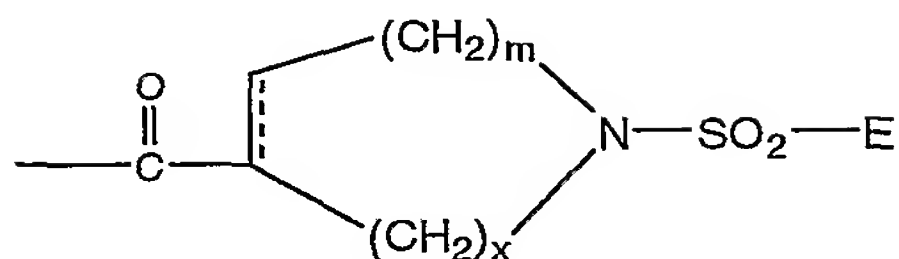


(式中、Z³は=N-または=C(-R⁷)-; R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷はそれぞれ独立して水素、ハロゲン、ハロアルキル、カルボキシ、アルキルオキシカルボニル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置

- 換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいアラルキル、式： $-S(O)_p R^8$ （式中、 p は0～2の整数；および R^8 はアルキルまたは置換されていてもよいアリール）で示される基、式： $-N R^9 R^{10}$ （式中、 R^9 および R^{10} はそれぞれ独立して水素、アルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキルまたはアシル）で示される基、式： $-O R^{11}$ （式中、 R^{11} は水素、アルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル、アルカンスルホニル、置換されていてもよいアリールスルホニル、置換されていてもよいアラルキルスルホニル、ハロアルキル）で示される基；
- 10 R^1 はカルボキシ、アルキルオキシカルボニル、置換されていてもよいアミノカルボニルまたはテトラゾリル；
- Z^4 は $-N=$ または $-C(-R^2)=$ ；
- R^2 は水素、アルキルまたはハロゲン；
- R^{15} は水素またはアルキル；
- 15 R^3 は式： $-(CH_2)_n-N(-Y)-SO_2-Ar$ （式中、 n は1～3の整数； Y は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアリールアルキルまたは置換されていてもよいアリールアルケニル；および Ar は置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリール）で示される基、
- 20 式：



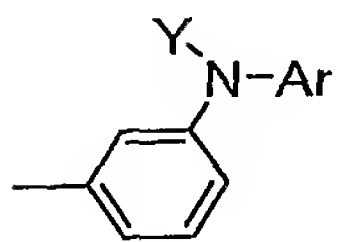
- （式中、 r は0～2の整数； x は0～3の整数； m は1～3の整数；破線は結合の存在または不存在を表わし； E は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、アルキル、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいアリールアルケニル）で示される基、
- 25 式：



(式中、 x は0～3の整数； m は1～3の整数；破線は結合の存在または不存在を表わし； E は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、アルキル、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいアリールアルケニル)で示される基、

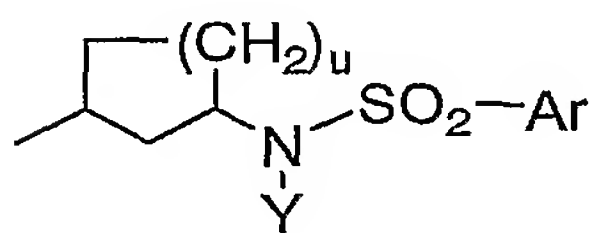
式： $-CR^{23}R^{24}-CR^{25}R^{26}-(CH_2)_y-N(-Y)-SO_2-Ar$ (式中、 Ar および Y は前記と同意義； y は0または1； R^{23} および R^{24} の一方はアルキル、他方は水素、アルキルまたはアリール；または R^{23} および R^{24} は一緒になって式： $-(CH_2)_t-$ (式中、 t は2～5の整数)で示される基； R^{25} および R^{26} はそれぞれ独立して水素またはアルキルオキシアルキル)で示される基、

式：



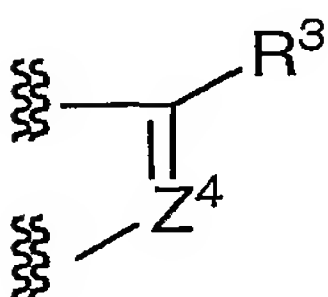
(式中、 Y および Ar は前記と同意義)で示される基、または

式：

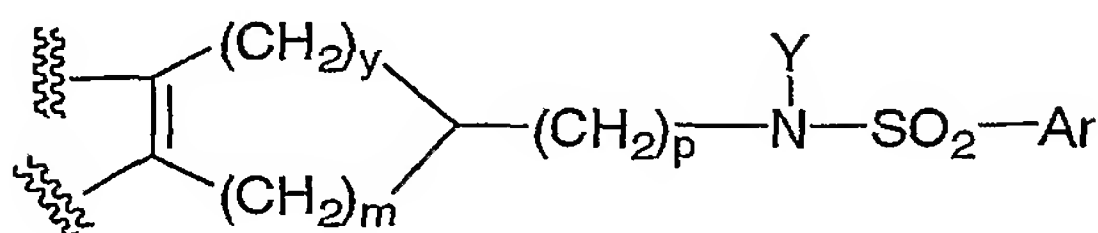


(式中、 Y および Ar は前記と同意義； u は1または2)で示される基；

または式：

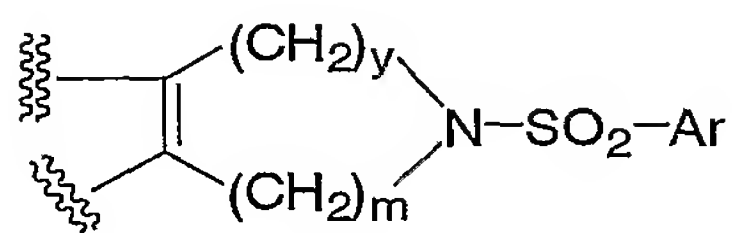


で示される基が式：



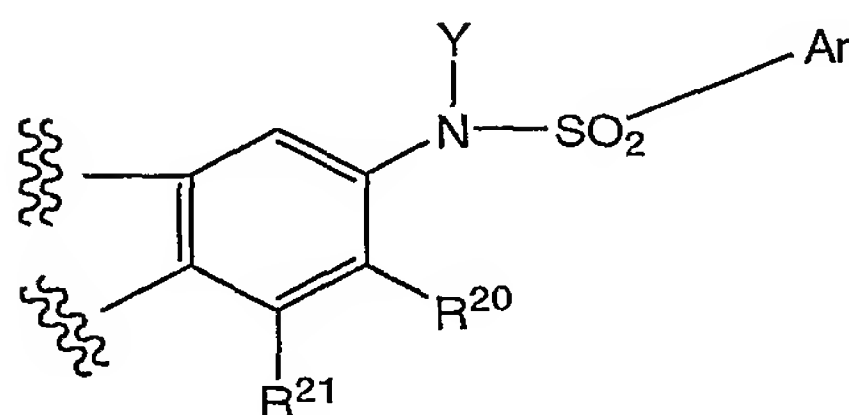
(y は 1 ~ 3 の整数 ; m 、 p 、 Y および Ar は前記と同意義) で示される基、

式 :



(m 、 y および Ar は前記と同意義) で示される基、

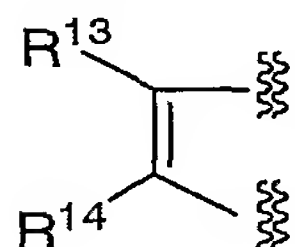
5 または式 :



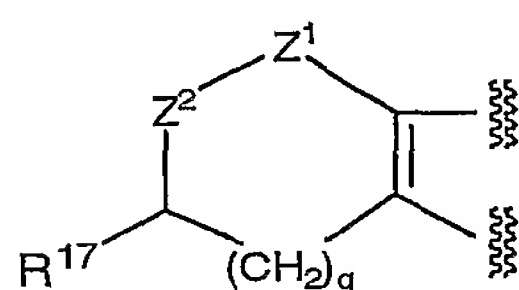
(Y および Ar は前記と同意義 ; R^{20} は水素またはアルキル ; R^{21} は水素またはハロゲン) で示される基である。(但し、3-(4-クロロフェニルスルホニルアミノ)-9-(2-カルボキシメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロカルバゾール、そのエチルエステル、3-(4-クロロフェニルスルホニルアミノエチル)インドール-1-アセティック
10 アシッド、および 3-(4-クロロフェニルスルホニルアミノプロピル)インドール-1-アセティックアシッドを除く) ;

または R^{13} が水素、アルキル、アラルキル、アシルまたは式 : $-OR^{16}$ (式中、 R^{16} は水素またはアルキル) で示される基であり、 R^{14} が水素またはアルキル

15 であるか、または式 :



で示される基が式 :



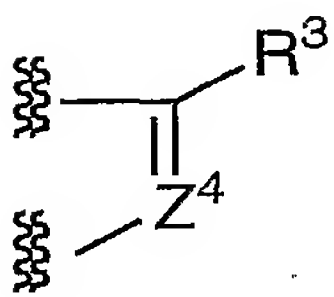
(式中、 q は 0 ~ 3 の整数 ; R^{17} は水素またはアルキル ; Z^1 は $-CH_2-$ 、 $-$

20 $C(=O)-$ 、 $-C(=NOH)-$ 又は $-C(=NOMe)-$; Z^2 は式 : $-S$

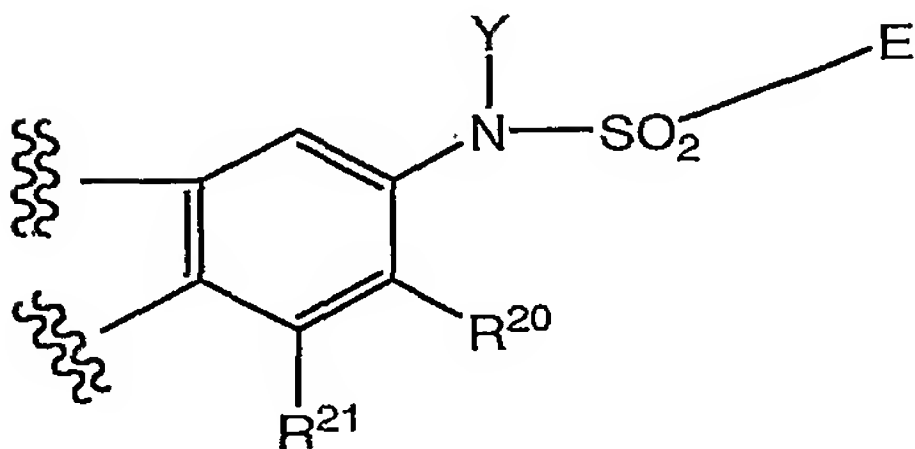
(=O)_s - (式中、s は 0 ~ 2 の整数) で示される基、式：-N(-R²²)-
 (式中、R²² は水素、アルキル、アルキルオキシカルボニルまたはアシル) で示
 される基または式：-C R¹⁸ R¹⁹ - (式中、R¹⁸ および R¹⁹ はそれぞれ独立し
 て水素、アルキルまたはアリール；または R¹⁸ および R¹⁹ は一緒になって式：
 5 - (CH₂)_t - (式中、t は 2 ~ 5 の整数) で示される基である) で示される基
 である) で示される基であり；

R¹ および R¹⁵ は前記と同意義であり；

式：

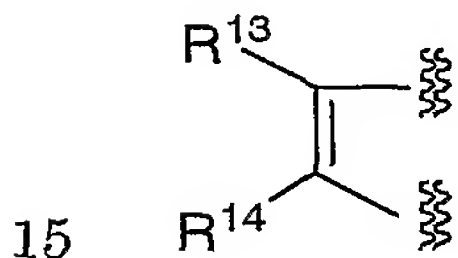


10 で示される基が式：

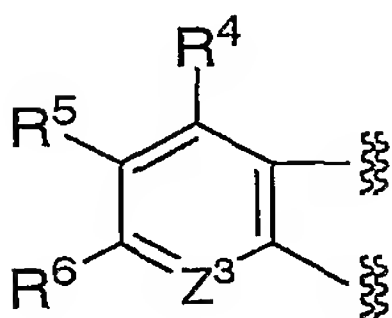


(Y、E、R²⁰ および R²¹ は前記と同意義) で示される基である化合物、その
 プロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

II) 式：



15 で示される基が式：



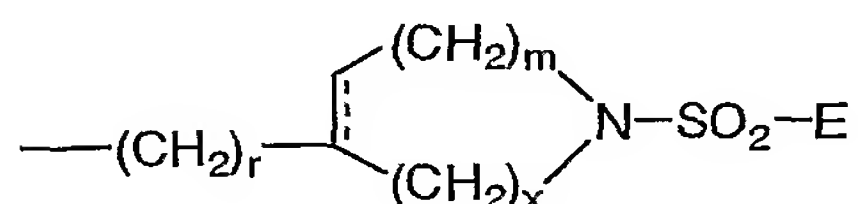
(式中、Z³ は =C(-R⁷)- であり；R⁴、R⁵、R⁶ および R⁷ は I) と同意
 義) で示される基であり；Z⁴ が -C(-R²)= であり；R² は I) と同意義で

あり； R^{15} が水素であり；

R^3 が式： $-(CH_2)_n-N(-Y)-SO_2-Ar$ （式中、 n は1～3の整数；

Y は水素、アルキル、アルケニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル、または置換されていてもよいヘテロアリールアルキル；

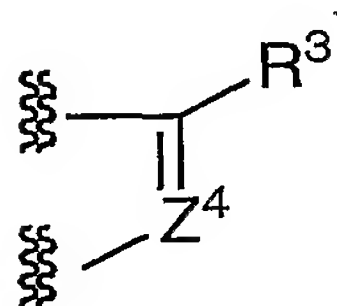
- 5 および Ar は置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリール）で示される基、式：



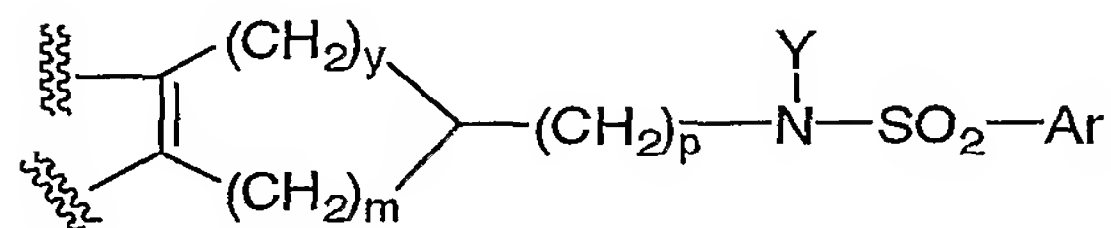
（式中、 r は0～2の整数； x は0～3の整数； m は1～3の整数；破線は結合の存在または不存在を表わし； E は置換されていてもよいアリールまたは置換さ

- 10 れていてもよいヘテロアリール）で示される基；

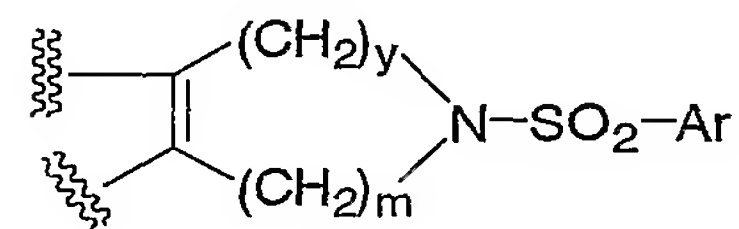
または式：



で示される基が式：

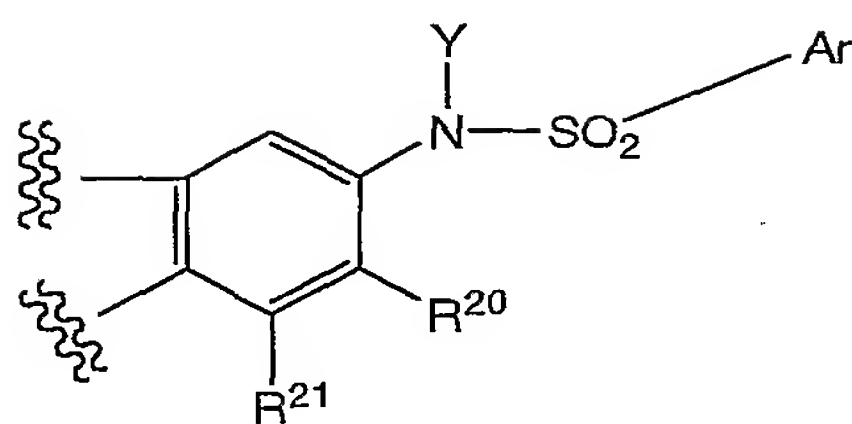


- 15 （ y は1～3の整数； m 、 p 、 Y および Ar は前記と同意義）で示される基、式：



（ m 、 y および Ar は前記と同意義）で示される基、

または式：



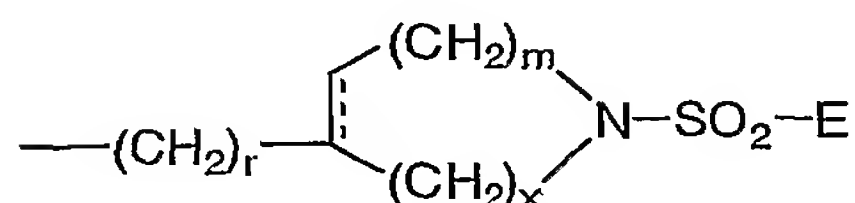
(YおよびArはI)と同意義であり； R^{20} および R^{21} は水素である)で示される基であるI)項記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

- 5 I I I) Yがアルキル、アルケニル、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいアラルキルであるI)またはI I)記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

I V) R^3 が式： $-(CH_2)_n-N(-Y)-SO_2-Ar$ (式中、nは2または3；Yは水素、アルキル、アルケニル、またはアラルキル；およびArはI)

- 10 と同意義)で示される基であるI I)記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

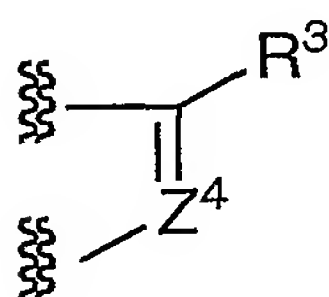
V) R^3 が式：



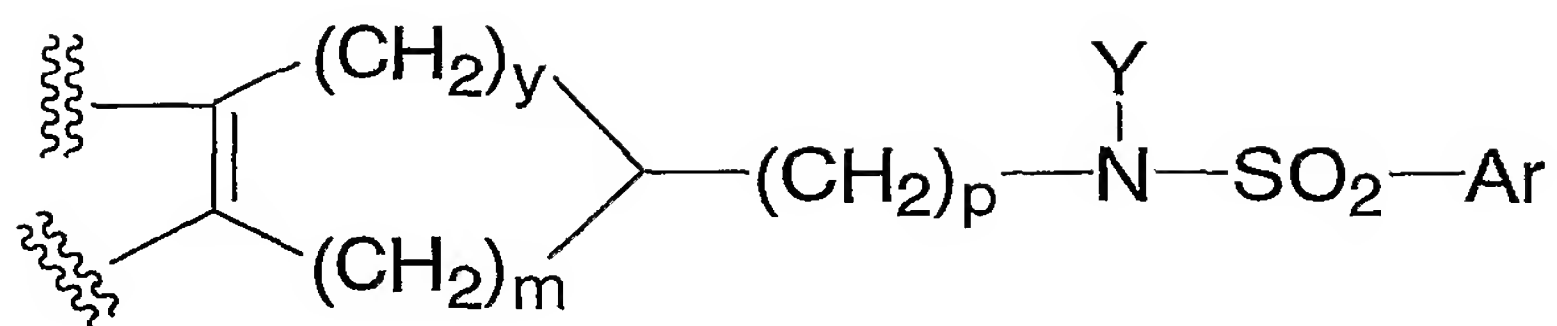
(式中、mは1；rは0；xは2；破線は結合の不存在を表わし；およびEはI

- 15 I)と同意義)で示される基であるI I)に記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

V I) 式：

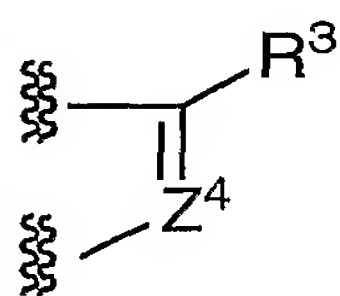


で示される基が式：

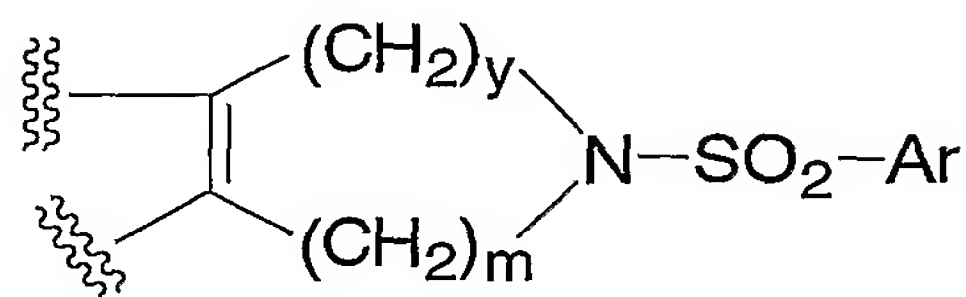


(m は 2 ; p は 0 ; y は 1 ; Y は水素、アルキル、アルケニルまたはアラルキル ; および Ar は I) と同意義) で示される基である I I) に記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

5 V I I) 式 :

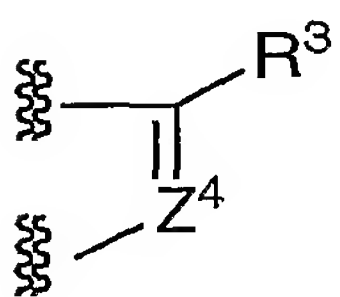


で示される基が式 :

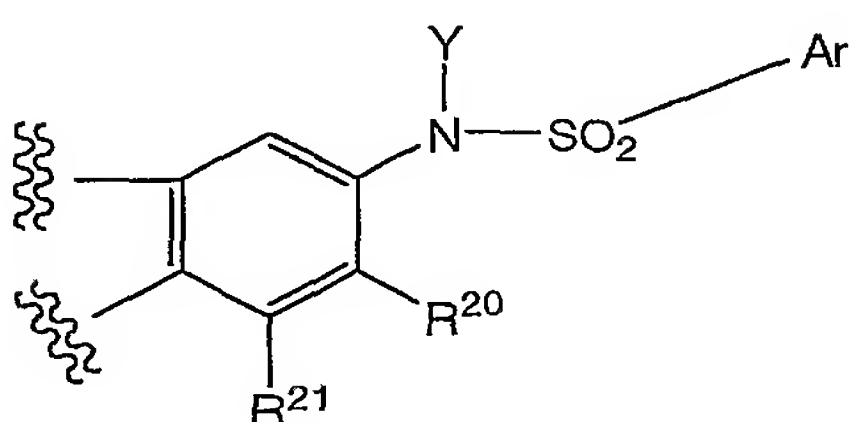


(m は 1 または 2 ; y は 1 または 2 ; および Ar は I I) と同意義) で示される
10 基である I I) に記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

V I I I) 式 :



で示される基が式 :



15

(Y は水素、アルキル、アルケニルまたはアラルキル ; および R^{20} 、 R^{21} およ

びA rはI)と同意義)で示される基であるI I)記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

I X) R¹がカルボキシであるI)～V I I I)のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

- 5 X) R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷がそれぞれ独立して水素、ハロゲン、アルキル、アルケニル、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいアラキルであるI)～I X)のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

- X I) R²が水素またはアルキルであるI)～X)のいずれかに記載の化合物、
10 そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

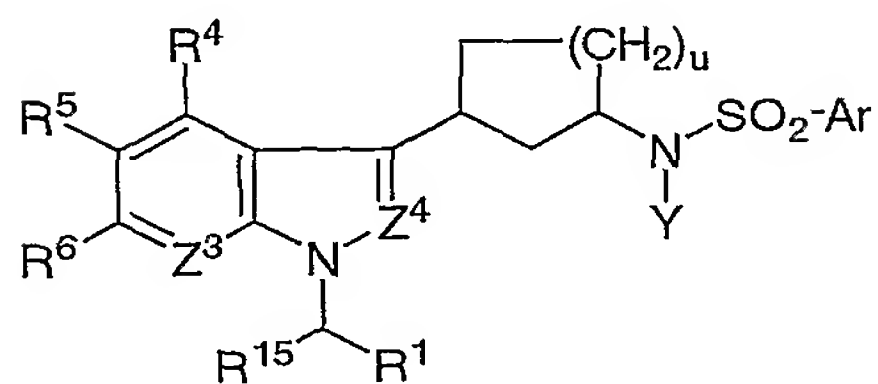
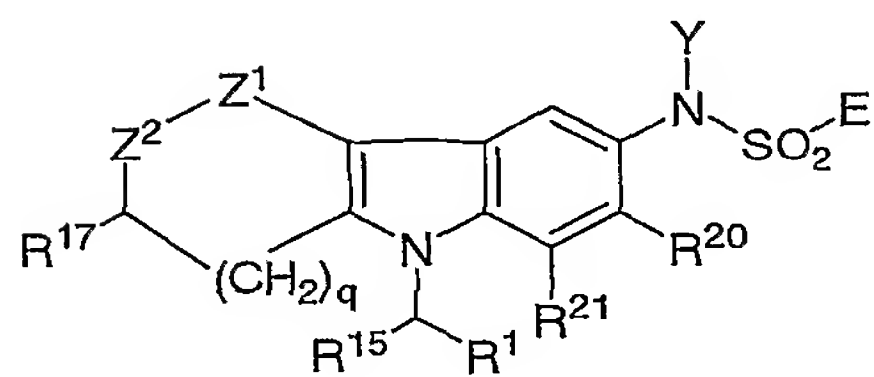
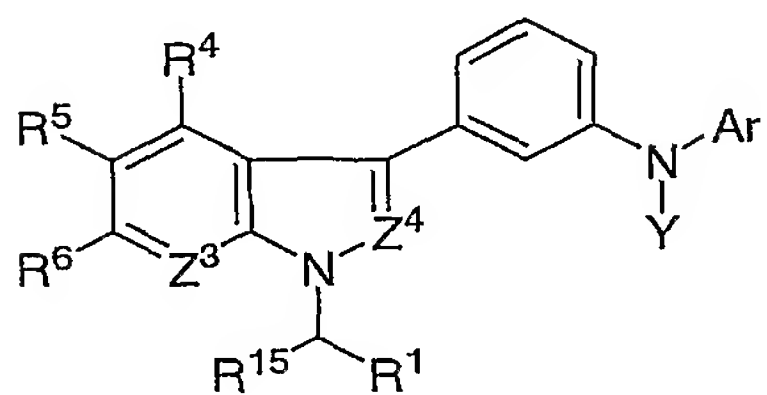
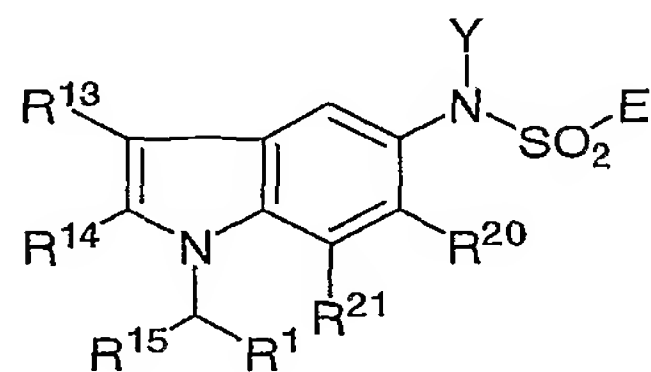
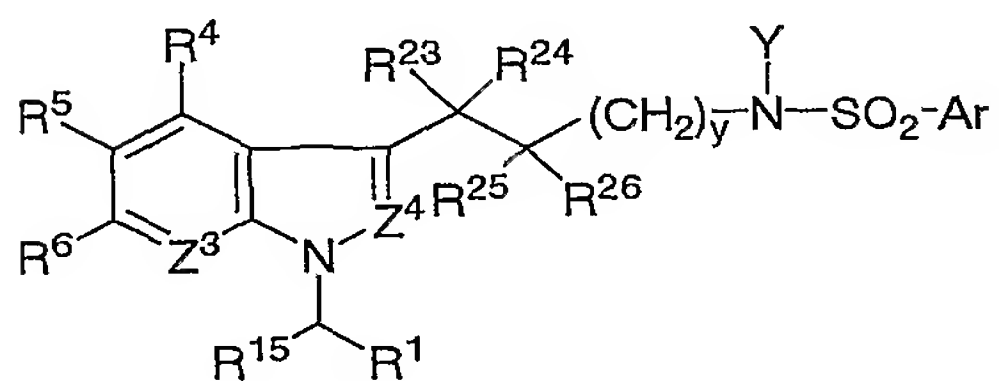
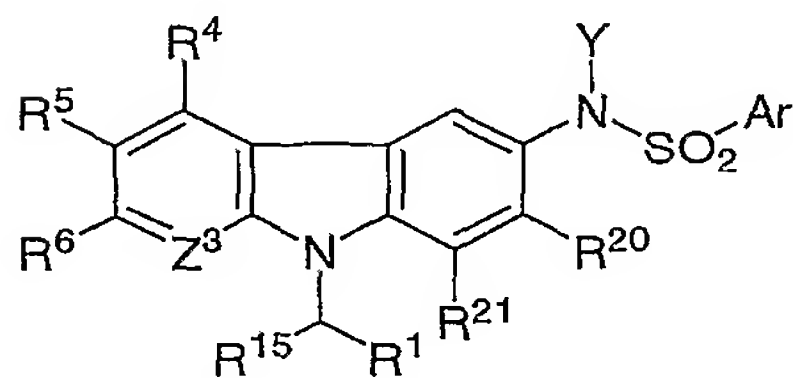
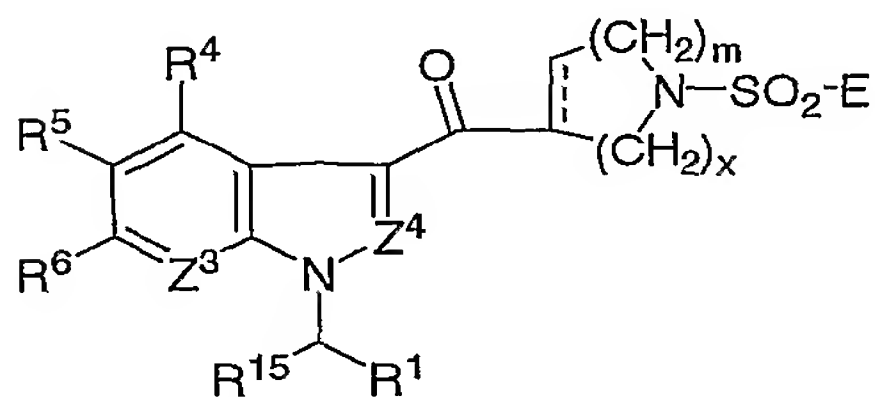
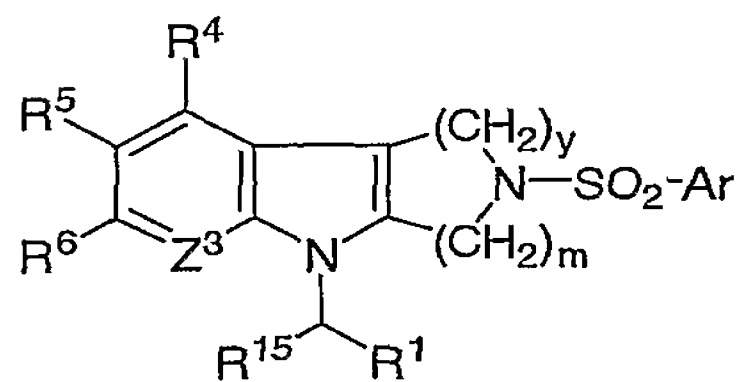
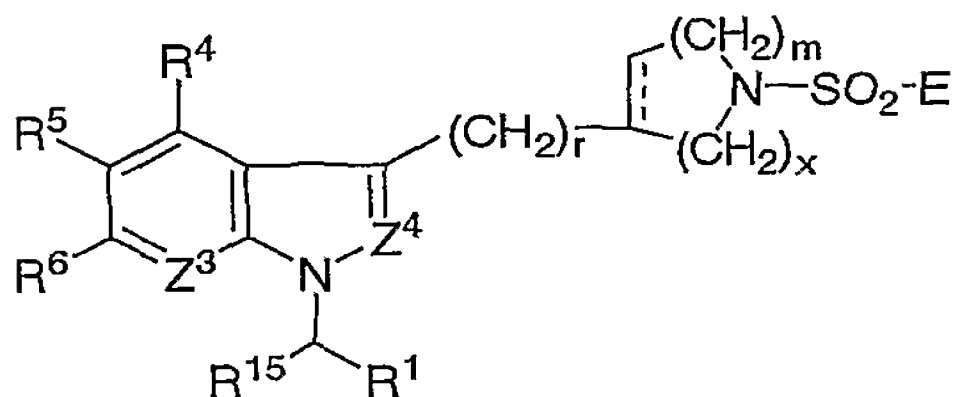
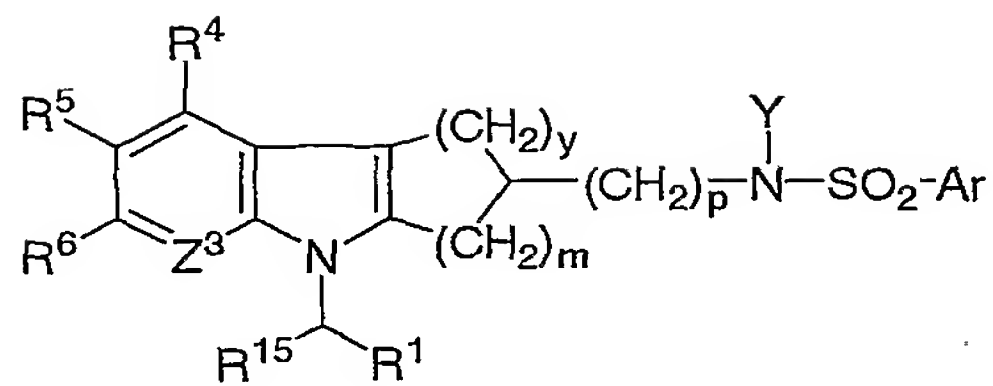
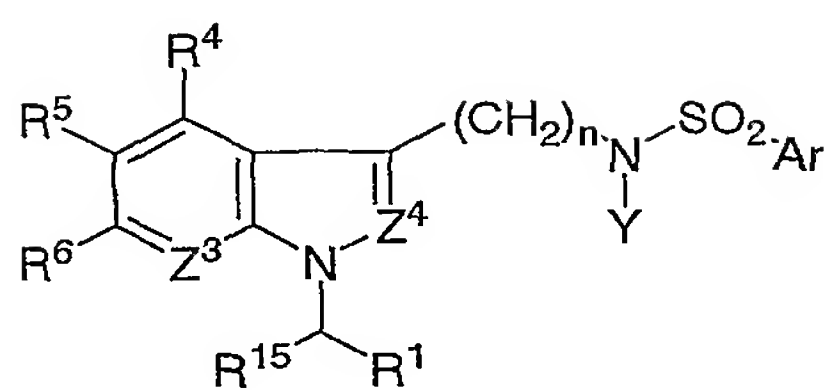
X I I) I)～X I)のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物を有効成分として含有する医薬組成物。

X I I I) C R T H 2受容体拮抗剤として使用するX I I)記載の医薬組成物。

- 15 X I V) I)に記載の化合物を投与することを特徴とするC R T H 2受容体に関する疾患の治療方法。

X V) C R T H 2受容体に関する疾患の治療剤を製造するための、I)に記載の化合物の使用。

- 20 式(I)で示される化合物には、以下の化合物が含まれる。



(上記構造式中、各用語は I) と同意義である。)

以下に本発明を詳細に説明する。

本明細書中、「ハロゲン」とは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素を意味する。ハロゲンとしては、フッ素、塩素、および臭素が好ましい。

本明細書中、単独もしくは他の用語と組み合わせて用いられる「アルキル」とは、炭素原子数 1 ～ 8 の直鎖または分枝鎖の 1 価の炭化水素基を包含する。例えば、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、イソペンチル、*neo*-ペンチル、*n*-ヘキシル、イソヘキシル、*n*-ヘプチル、*n*-オクチル等が挙げられる。好ましくは、C 1 ～ C 6 アルキルが挙げられる。さらに好ましくは、C 1 ～ C 3 アルキルが挙げられる。

本明細書中、単独もしくは他の用語と組み合わせて用いられる「シクロアルキル」とは、炭素原子数が 3 ～ 8 個であるシクロアルキルを包含する。例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチルが挙げられる。好ましくは C 3 ～ C 6 シクロアルキルが挙げられる。

本明細書中、単独もしくは他の用語と組み合わせて用いられる「アルケニル」とは、炭素原子数が 2 ～ 8 個であり、1 個もしくは 2 個以上の二重結合を有する、直鎖または分枝鎖の 1 価の炭化水素基を包含する。例えば、ビニル、アリル、1-プロペニル、2-プロペニル、クロトニル、イソペンテニル、種々のブテニル異性体等が挙げられる。好ましくは、C 2 ～ C 6 アルケニルが挙げられる。さらに好ましくは、C 2 ～ C 4 アルケニルが挙げられる。

本明細書中、単独もしくは他の用語と組み合わせて用いられる「アルキニル」とは、炭素原子数が 2 ～ 8 個であり、1 個もしくは 2 個以上の三重結合を有する、直鎖または分枝鎖の 1 価の炭化水素基を包含する。例えば、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル等が挙げられる。好ましくは、C 2 ～ C 6 アルキニルが挙げられる。さらに好ましくは、C 2 ～ C 4 アルキニルが挙げられる。

本明細書中、単独もしくは他の用語と組み合わせて用いられる「アリアル」とは、単環状もしくは縮合環状芳香族炭化水素を包含する。例えば、フェニル、

1-ナフチル、2-ナフチル、アントリル等が挙げられる。好ましくは、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチルが挙げられる。さらに好ましくは、フェニルが挙げられる。

本明細書中、単独でもしくは他の用語と組み合わせて用いられる「アラルキル」とは、前記「アルキル」に前記「アリアル」が1または2以上置換したものを包含し、これらは可能な全ての位置で置換しうる。例えば、ベンジル、フェニルエチル（例えば、2-フェニルエチル等）、フェニルプロピル（例えば、3-フェニルプロピル等）、ナフチルメチル（例えば、1-ナフチルメチル、2-ナフチルメチル等）、アントリルメチル（例えば、9-アントリルメチル等）等が挙げられる。好ましくは、ベンジル、2-フェニルエチル、1-ナフチルメチル、2-ナフチルメチルが挙げられる。さらに好ましくはベンジル、2-フェニルエチルが挙げられる。

本明細書中、「アラルキル」とは、前記「アルキル」に前記「アリアル」が1または2以上置換したものを包含し、これらは可能な全ての位置で置換しうる。例えば、ベンジル、フェニルエチル（例えば、2-フェニルエチル等）、フェニルプロピル（例えば、3-フェニルプロピル等）、ナフチルメチル（例えば、1-ナフチルメチル、2-ナフチルメチル等）、アントリルメチル（例えば、9-アントリルメチル等）等が挙げられる。好ましくは、ベンジル、2-フェニルエチル、1-ナフチルメチル、2-ナフチルメチルが挙げられる。さらに好ましくはベンジル、2-フェニルエチルが挙げられる。

本明細書中、「アリアルアルケニル」とは、前記「アルケニル」に前記「アリアル」が1または2以上置換したものを包含し、これらは可能な全ての位置で置換しうる。例えば、フェニルアリル、ナフチルアリル等が挙げられる。

本明細書中、「非芳香族複素環基」なる用語は、任意に選ばれる、酸素原子、硫黄原子または窒素原子を環内に1個以上含む非芳香族の5～7員環またはそれらが2個以上縮合した環を包含する。例えば、ピロリジニル（例えば、1-ピロリジニル、2-ピロリジニル）、ピロリニル（例えば、3-ピロリニル）、イミ

ダゾリジニル（例えば、2-イミダゾリジニル）、イミダゾリニル（例えば、イミダゾリニル）、ピラゾリジニル（例えば、1-ピラゾリジニル、2-ピラゾリジニル）、ピラゾリニル（例えば、ピラゾリニル）、ピペリジル（例えば、ピペリジノ、2-ピペリジル）、ピペラジニル（例えば、1-ピペラジニル）、イン
5 ドリニル（例えば、1-インドリニル）、イソインドリニル（例えば、イソインドリニル）、モルホリニル（例えば、モルホリノ、3-モルホリニル）等が挙げられる。

本明細書中、単独でもしくは他の用語と組み合わせて用いられる「ヘテロアリアル」とは、任意に選ばれる、酸素原子、硫黄原子または窒素原子を環内に1個
10 以上含む5～6員の芳香環を包含する。これは前記「シクロアルキル」、前記「アリアル」、前記「非芳香族複素環基」、もしくは他のヘテロアリアルと可能な全ての位置で縮合していてもよい。ヘテロアリアルが単環および縮合環のいずれである場合も、すべての可能な位置で結合しうる。例えば、ピロリル（例えば、1-
15 -ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル）、フリル（例えば、2-フリル、3-フリル）、チエニル（例えば、2-チエニル、3-チエニル）、イミダゾリル（例えば、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル）、ピラゾリル（例えば、1-
ピラゾリル、3-ピラゾリル）、イソチアゾリル（例えば、3-イソチアゾリル）、イソキサゾリル（例えば、3-イソキサゾリル）、オキサゾリル（例えば、2-
20 オキサゾリル）、チアゾリル（例えば、2-チアゾリル）、ピリジル（例えば、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル）、ピラジニル（例えば、2-ピラジニル）、ピリミジニル（例えば、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル）、ピリダジニル（例えば、3-ピリダジニル）、テトラゾリル（例えば、1H-テトラゾリル）、オキサジアゾリル（例えば、1, 3, 4-オキサジアゾリル）、チア
25 ジアゾリル（例えば、1, 3, 4-チアジアゾリル）、インドリジニル（例えば、2-インドリジニル、6-インドリジニル）、イソインドリル（例えば、2-イソインドリル）、インドリル（例えば、1-インドリル、2-インドリル、3-インドリル）、インダゾリル（例えば、3-インダゾリル）、プリニル（例

え、8-プリニル)、キノリジニル(例えば、2-キノリジニル)、イソキノ
リル(例えば、3-イソキノリル)、キノリル(例えば、2-キノリル、5-キノ
リル)、フタラジニル(例えば、1-フタラジニル)、ナフチリジニル(例え
ば、2-ナフチリジニル)、キノラニル(例えば、2-キノラニル)、キナゾリ
5 ニル(例えば、2-キナゾリニル)、シンノリニル(例えば、3-シンノリニル)、
プテリジニル(例えば、2-プテリジニル)、カルバゾリル(例えば、2-カル
バゾリル、4-カルバゾリル)、フェナントリジニル(例えば、2-フェナント
リジニル、3-フェナントリジニル)、アクリジニル(例えば、1-アクリニジ
ル、2-アクリニジル)、ジベンゾフラニル(例えば、1-ジベンゾフラニル、
10 2-ジベンゾフラニル)、ベンゾイミダゾリル(例えば、2-ベンゾイミダゾリ
ル)、ベンゾイソキサゾリル(例えば、3-ベンゾイソキサゾリル)、ベンゾオ
キサゾリル(例えば、2-ベンゾオキサゾリル)、ベンゾオキサジアゾリル(例
えば、4-ベンゾオキサジアゾリル)、ベンゾイソチアゾリル(例えば、3-ベ
ンゾイソチアゾリル)、ベンゾチアゾリル(例えば、2-ベンゾチアゾリル)、
15 ベンゾフリル(例えば、3-ベンゾフリル)、ベンゾチエニル(例えば、2-ベ
ンゾチエニル)、ジベンゾチエニル(例えば、2-ジベンゾチエニル)、ベンゾ
ジオキサソリル(例えば、1, 3-ベンゾジオキサソリル)等が挙げられる。

A rにおける「ヘテロアリール」としては、チエニル、ベンゾチエニル、ジベ
ンゾチエニル、ベンゾジオキサソリル、オキサゾリル等が好ましい。

20 本明細書中、「ヘテロアリールアルキル」とは、前記「アルキル」の任意の位
置に前記「ヘテロアリール」が1または2以上置換したものを包含し、これらは
可能な全ての位置で置換しうる。チエニルアルキル、フリルアルキル、ピロリル
アルキル、イミダゾリルアルキル、ピラゾリルアルキル、チアゾリルアルキル、
イソチアゾリルアルキル、イソキサゾリルアルキル、オキサゾリルアルキル、ピ
25 リジルアルキル等が例示される。例えば、チエニルメチル(例えば、2-チエニ
ルメチル)、チエニルエチル(例えば、2-(チオフェン-2-イル)エチル)、
フリルメチル(例えば、2-フリルメチル)、フリルエチル(例えば2-(フラ

ン-2-イル)エチル)、ピロリルメチル(例えば、2-ピロリルメチル)、ピ
ロリルエチル(例えば、2-(ピロール-2-イル)エチル)、イミダゾリルメ
チル(例えば、2-イミダゾリルメチル、4-イミダゾリルメチル)、イミダゾ
リルエチル(例えば、2-(イミダゾール-2-イル)エチル)、ピラゾリルメ
5 チル(例えば、3-ピラゾリルメチル)、ピラゾリルエチル(例えば、2-(ピ
ラゾール-3-イル)エチル)、チアゾリルメチル(例えば、2-チアゾリルメ
チル)、チアゾリルエチル(例えば、2-(チアゾール-2-イル)エチル)、
イソチアゾリルメチル(例えば、3-イソチアゾリルメチル)、イソキサゾリル
メチル(例えば、3-イソキサゾリルメチル)、オキサゾリルメチル(例えば、
10 2-オキサゾリルメチル)、オキサゾリルエチル(例えば、2-(オキサゾール
-2-イル)エチル)、ピリジルメチル(例えば、2-ピリジルメチル、3-ピ
リジルメチル、4-ピリジルメチル)、ピリジルエチル(例えば、2-ピリジル
エチル)等が挙げられる。

Yにおける「ヘテロアリール」としては、チエニルメチル等が好ましい。

15 本明細書中、「アルキルオキシ」としては、メチルオキシ、エチルオキシ、n
-プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、n-ブチルオキシ、イソブチルオキシ、
s e c -ブチルオキシ、t e r t -ブチルオキシ等が挙げられる。好ましくは、
メチルオキシ、エチルオキシ、n-プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、n-
ブチルオキシが挙げられる。特に好ましくは、C1~C3アルキルオキシが挙げ
20 られる。

本明細書中、「アルキルチオ」としては、メチルチオ、エチルチオ、n-プロ
ピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、イソブチルチオ、s e c -ブチ
ルチオ、t e r t -ブチルチオ等が挙げられる。好ましくは、メチルチオ、エチ
ルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオが挙げられる。
25 特に好ましくは、C1~C3アルキルチオが挙げられる

本明細書中、「アリールオキシ」としては、フェニルオキシ、ナフチルオキシ
等が挙げられる。

本明細書中、「アリアルチオ」としては、フェニルチオ、ナフチルチオ等が挙げられる。

本明細書中、「アリアルアゾ」としては、フェニルアゾ、ナフチルアゾ等が挙げられる。

- 5 本明細書中、「アルキルオキシカルボニル」としては、メチルオキシカルボニル、エチルオキシカルボニル、*n*-プロピルオキシカルボニル、イソプロピルオキシカルボニル、*n*-ブチルオキシカルボニル、*tert*-ブチルオキシカルボニル、*n*-ペンチルオキシカルボニル等が挙げられる。好ましくは、メチルオキシカルボニル、エチルオキシカルボニルが挙げられる。特に好ましくは、C 1 ~
10 C 3 アルキルオキシカルボニルが挙げられる

本明細書中、単独でもしくは他の用語と組み合わせて用いられる「アシル」なる用語は、アルキル部分が前記「アルキル」であるアルキルカルボニルまたはアリアル部分が前記「アリアル」であるアリアルカルボニルを包含する。「アルキル」および「アリアル」はそれぞれ後述の「置換されていてもよいアルキル」および「置換されていてもよいアリアル」において例示された置換基によって置換されていてもよい。例えば、アセチル、プロピオニル、ブチロイル、ベンゾイル等が挙げられる。

本明細書中、単独でもしくは他の用語と組み合わせて用いられる「ハロアルキル」なる用語は、前記「ハロゲン」によって 1 ~ 8 ケ所、好ましくは 1 ~ 5 ケ所置換された前記「アルキル」を包含する。例えば、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、ジクロロエチル、トリクロロエチル、クロロメチル等が挙げられる。好ましくは、トリフルオロメチルが挙げられる。

本明細書中、「アシルオキシ」としては、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ベンゾイルオキシ等が挙げられる。

本明細書中、「アルカンスルホニル」としては、メタンスルホニル、エタンスルホニル、*n*-プロパンスルホニル、イソプロパンスルホニル、*n*-ブタンスル

ホニル、イソブタンスルホニル、*sec*-ブタンスルホニル、*tert*-ブタンスルホニル等が挙げられる。好ましくは、メタンスルホニル、エタンスルホニルが挙げられる。

5 本明細書中、「アリールスルホニル」としては、フェニルスルホニル、ナフチルスルホニル等が挙げられる。

本明細書中、「アラルキルスルホニル」としては、ベンジルスルホニル、フェニルエチルスルホニル等が挙げられる。

本明細書中、「ヘテロアリールスルホニル」としては、ピロリルスルホニル等が挙げられる。

10 本明細書中、単独でもしくは他の用語と組み合わせて用いられる「置換されていて
いてもよいアミノ」なる用語は、前記「アルキル」、前記「アリール」、前記「アラ
ルキル」、前記「ヘテロアリール」、前記「ヘテロアリールアルキル」、前記
「アシル」、前記「アルキルオキシカルボニル」および／または前記「アルカン
スルホニル」で1または2個所置換されいてもよいアミノを包含する。例えば、
15 アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、エチルメチルアミノ、ジエチルアミノ、
エチルメチルアミノ、ベンジルアミノ、アセチルアミノ、ベンゾイルアミノ、メ
チルオキシカルボニルアミノ、メタンスルホニルアミノ等が挙げられる。好まし
くはアミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、エチルメチルアミノ、ジエチルア
ミノ、アセチルアミノ、メタンスルホニルアミノが挙げられる。

20 本明細書中、「置換されていていてもよいアミノカルボニル」としては、アミノカ
ルボニル、メチルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、エチルメチル
アミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、ベンジルアミノ、アセチルアミ
ノ、メタンスルホニルアミノカルボニル等が挙げられる。好ましくは、アミノカ
ルボニル、メチルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、メタンスルホ
25 ニルアミノカルボニルが挙げられる。

本明細書中、「置換されていていてもよいウレイド」なる用語は、前記「アルキル」、
前記「アリール」、前記「アラルキル」、前記「ヘテロアリール」、前記「ヘテ

ロアリールアルキル」、または前記「アシル」で 1 または 2 ケ所以上置換されいてもよいウレイドを包含する。

本明細書中、「置換されていてもよいアルキル」における置換基としては、シクロアルキル、アルケニル、アルキリデン、ヒドロキシ、アルキルオキシ、メル
5 カプト、アルキルチオ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、カルボキシ、アルキルオキシカルボニル、ハロアルキル、ハロアルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ、置換されていてもよいアミノカルボニル、アシル、アシルオキシ、置換されていてもよい非芳香族複素環基、アリールオキシ（例えば、フェニルオキシ）、アラ
10 ルアルキルオキシ（例えば、ベンジルオキシ）、アルカンスルホニル、グアニジノ、アゾ基等が挙げられる。これらは、全ての可能な位置で 1 個以上置換しうる。

R^4 、 R^5 、 R^6 、および R^7 における「置換されていてもよいアルキル」の置換基としては、アルキルオキシ、ヒドロキシ、置換されていてもよいアミノ、アリールオキシ等が好ましい。

本明細書中、「置換されていてもよいシクロアルキル」における置換基としては、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキリデン、ヒドロキシ、アル
15 キルオキシ、メルカプト、アルキルチオ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、カルボキシ、アルキルオキシカルボニル、ハロアルキル、ハロアルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ、置換されていてもよいアミノカルボニル、アシル、アシルオキシ、アリールオキシ（例えば、フェニルオキシ）、アラ
20 ルアルキルオキシ（例えば、ベンジルオキシ）、アルカンスルホニル、グアニジノ、アゾ基等が挙げられる。これらは、全ての可能な位置で 1 個以上置換しうる。

R^4 、 R^5 、 R^6 、および R^7 における「置換されていてもよいシクロアルキル」の置換基としては、アルキル、ハロゲン等が好ましい。

本明細書中、「置換されていてもよいアルケニル」における置換基としては、アルキル、シクロアルキル、アルキリデン、ヒドロキシ、アルキルオキシ、メル
25 カプト、アルキルチオ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、カルボキシ、アルキルオキシカルボニル、ハロアルキル、ハロアルキルオキシ、置換されていてもよいアミ

ノ、置換されていてもよいアミノカルボニル、アシル、アシルオキシ、アリール、アリールオキシ（例えば、フェニルオキシ）、アラルキル、アラルキルオキシ（例えば、ベンジルオキシ）、アルカンスルホニル、グアニジノ、アゾ基等が挙げられる。これらは、全ての可能な位置で1個以上置換しうる。

- 5 R^4 、 R^5 、 R^6 、および R^7 における「置換されていてもよいアルケニル」の置換基としては、ハロゲン、アリール等が好ましい。

- 本明細書中、「置換されていてもよいアリール」、「置換されていてもよいアラルキル」、「置換されていてもよいヘテロアリール」、「置換されていてもよいアリールスルホニル」、「置換されていてもよいアラルキルスルホニル」、および「置換されていてもよい非芳香族複素環基」における置換基としては、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルキルオキシ、ハロアルキルオキシ、アリールオキシ、アラルキルオキシ、メルカプト、アルキルチオ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、カルボキシ、アルキルオキシカルボニル、アシル、アシルオキシ、アルカンスルホニル、グアニジノ、アゾ基、置換されていてもよいアミノ、置換されていてもよいアミノカルボニル、置換基群Cによって1または2ヶ所以上置換されていてもよいアリール、置換基群Cによって1または2ヶ所以上置換されていてもよいヘテロアリール、置換基群Cによって1または2ヶ所以上置換されていてもよい非芳香族複素環基、置換基群Cによって1または2ヶ所以上置換されていてもよいアラルキル、または置換されていてもよいウレイド等が挙げられる。これらは、全ての可能な位置で1個以上置換しうる（置換基群C：アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルキルオキシ、ハロアルキルオキシ、アリールオキシ、アラルキルオキシ、メルカプト、アルキルチオ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、カルボキシ、アルキルオキシカルボニル、アシル、アシルオキシ、アルカンスルホニル、グアニジノ、アゾ基、置換されていてもよいアミノ、および置換されていてもよいアミノカルボニル）。
- 10
15
20
25

R^4 、 R^5 、 R^6 、および R^7 における「置換されていてもよいアリール」の置

換基としては、アルキル、アルキルオキシ、ハロゲン等が好ましい。

R^8 における「置換されていてもよいアリール」の置換基としては、アルキル、アルキルオキシ、ハロゲン等が好ましい。

5 R^9 および R^{10} における「置換されていてもよいアリール」の置換基としては、アルキル、アルキルオキシ、ハロゲン等が好ましい。

R^{11} における「置換されていてもよいアリール」の置換基としては、アルキル、アルキルオキシ、ハロゲン等が好ましい。

Yにおける「置換されていてもよいアリール」の置換基としては、アルキル、アルキルオキシ、ハロゲン等が好ましい。

10 Arにおける「置換されていてもよいアリール」の置換基としては、アルキル、アルキルオキシ、アリールオキシ、ハロゲン、ベンジル、置換基群Bで置換されていてもよいフェニル等が好ましい（置換基群B：アルキル、アルキルオキシ、アリールオキシ、ハロゲン、およびベンジル）。

15 R^4 、 R^5 、 R^6 、および R^7 における「置換されていてもよいアラルキル」の置換基としては、アルキル、ハロゲン等が好ましい。

R^9 および R^{10} における「置換されていてもよいアラルキル」の置換基としては、アルキル、ハロゲン等が好ましい。

R^{11} における「置換されていてもよいアラルキル」の置換基としては、アルキル、ハロゲン等が好ましい。

20 Yにおける「置換されていてもよいアラルキル」の置換基としては、アルキル、アルキルオキシ、ニトロ、ハロゲン等が好ましい。

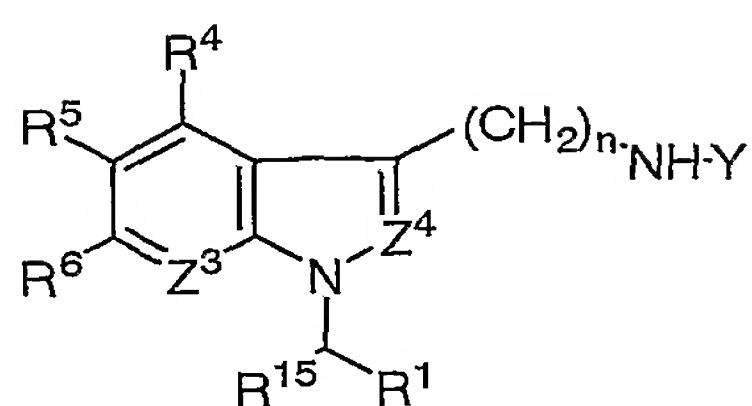
Arにおける「置換されていてもよいヘテロアリール」の置換基としては、アルキル、アルキルオキシ、アリールオキシ、ハロゲン、ベンジル、置換基群Bで置換されていてもよいフェニル等が好ましい（置換基群B：アルキル、アルキル
25 オキシ、アリールオキシ、ハロゲン、およびベンジル）。

R^{11} における「置換されていてもよいアリールスルホニル」の置換基としては、アルキル等が好ましい。

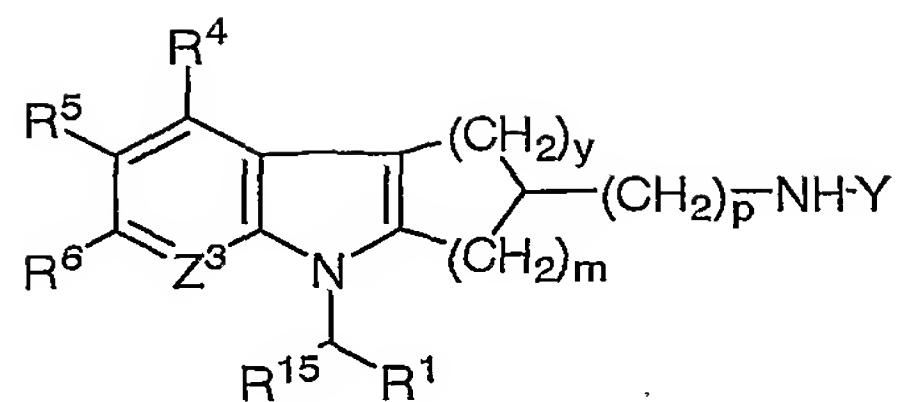
R¹¹における「置換されていてもよいアルキルスルホニル」の置換基としては、アルキル等が好ましい。

発明を実施するための最良の形態

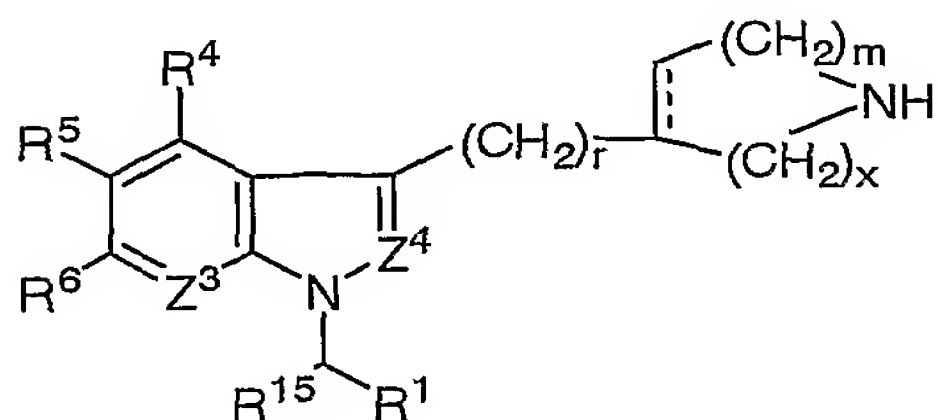
5 式（I）で表される本発明化合物は、以下の式（IIa）～（IIk）：



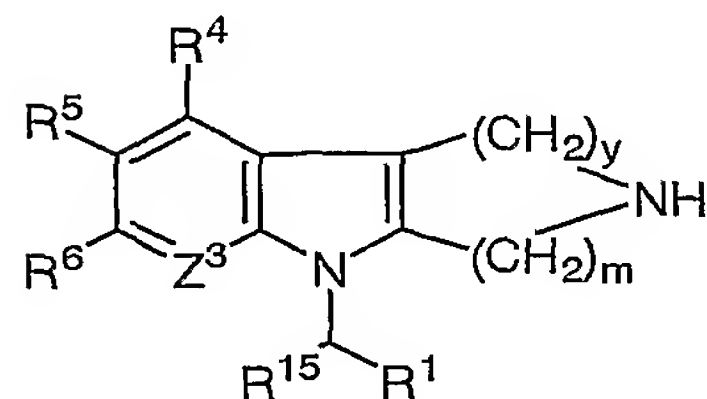
(IIa)



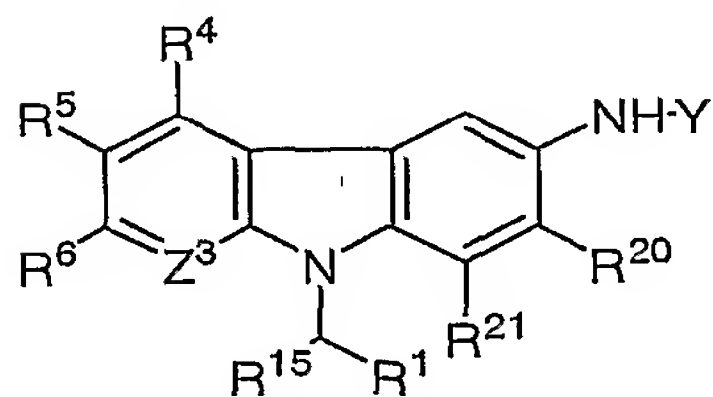
(IIb)



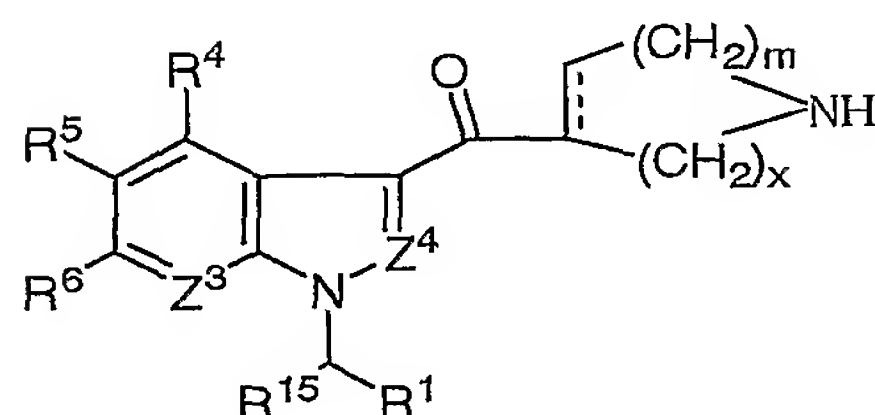
(IIc)



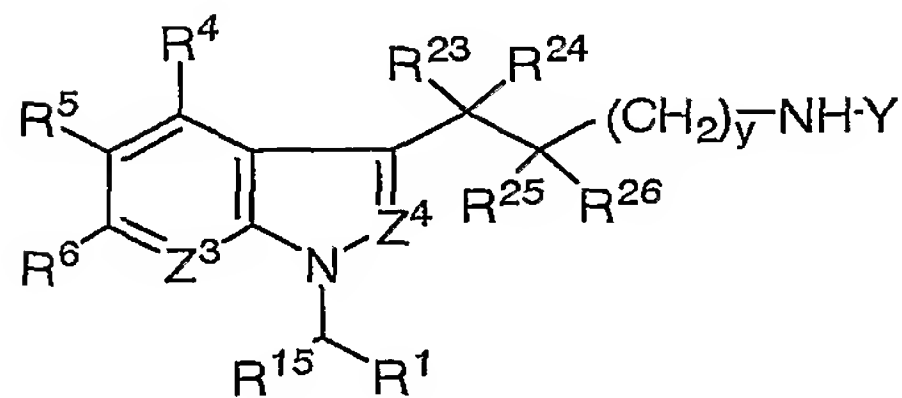
(IIId)



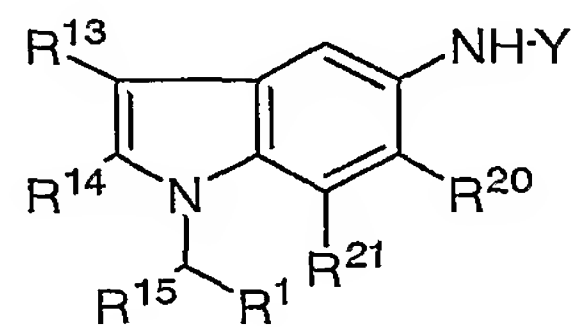
(IIe)



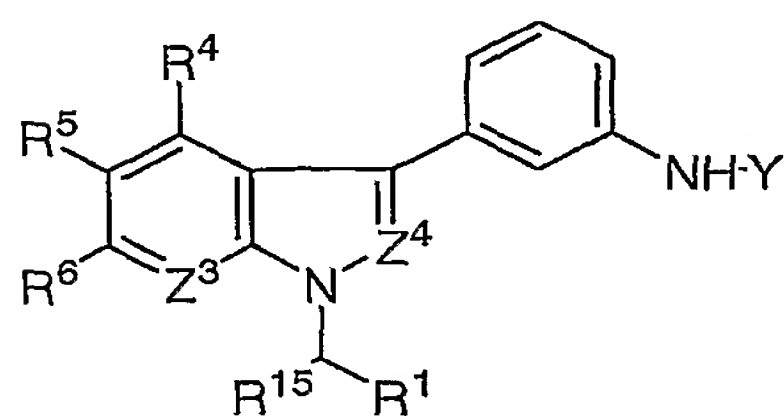
(IIIf)



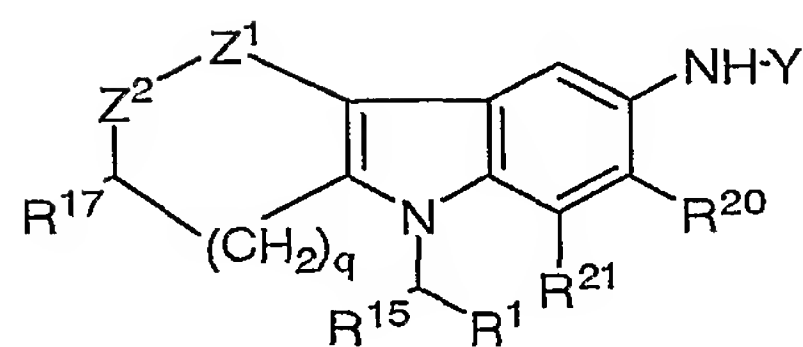
(IIg)



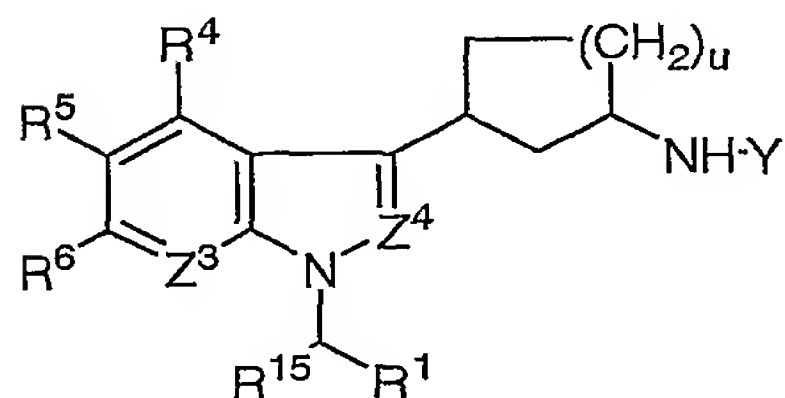
(IIh)



(IIi)



(IIj)



(IIk)

[式中、 R^1 はアルキルオキシカルボニル；他の記号はI)の定義と同意義]

で表される化合物またはその塩を、1～5当量の $Ar-SO_2-X^1$ または $E-S$

$O_2 - X^1$ で表される化合物〔式中Ar及びEはI〕の定義と同意義； X^1 はハロゲン〕と、不活性溶媒中、0℃から室温下、5分から数時間反応させることにより製造することができる。1当量から5当量の塩基の存在下に反応を行ってもよい。塩基としては、トリエチルアミン、ピリジン、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化ナトリウムなどが好ましい。不活性溶媒としては、ピリジン、アセトニトリル、塩化メチレン、テトラヒドロフラン（THF）などが好ましく、これらを単独あるいは水との混合溶媒として用いることができる。

上記反応によって得られた化合物のYが水素である場合は、THF、エーテル、N，N-ジメチルホルムアミド（DMF）、ジメチルスルホキシド（DMSO）、アセトニトリル、アセトン、トルエン等の不活性溶媒中、水素化ナトリウム、水素化カリウム、モーブトキシカリウム、炭酸カリウム等の塩基存在下、 $Y - X^2$

（ X^2 はハロゲン、置換されていてもよいアルカンスルホニルオキシまたは置換されていてもよいアリールスルホニルオキシ）と、0℃から80℃、30分から

数時間反応させ、Yがアルキル、アルケニル、置換されていてもよいアリール又は置換されていてもよいアラルキルである化合物を合成することができる。また、式（IIa）、（IIb）および（IIe）で表されるYが水素である化合物を、対応するアルデヒドまたはケトンと、THF、塩化メチレン等の溶媒中、1当量～5当量の水素化ホウ素ナトリウム、水素化シアノホウ素ナトリウムまたは水素化トリアセトキシホウ素ナトリウムを用いて、0℃から80℃、30分から数時間還元的アミノ化反応を行なうことによっても、Yがアルキル、アルケニル、または置換されていてもよいアラルキル等である化合物を合成することができる。

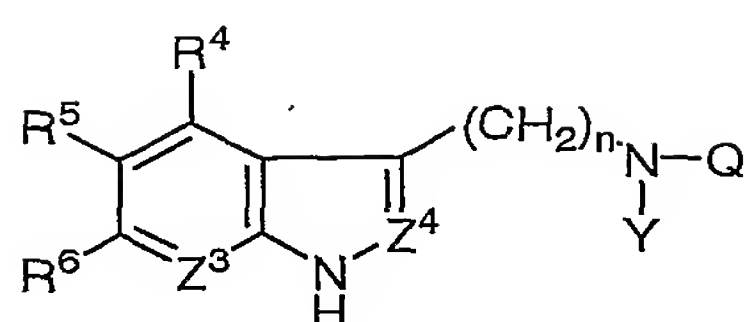
0.1当量～5当量の塩酸、酢酸、パラトルエンスルホン酸等の酸触媒存在下で反応を行ってもよい。その後上記スルホニル化反応を行ない、式（I）で表される化合物に変換することも可能である。

式（I）で表される化合物において、 R^1 がカルボキシである化合物は、上記反応後、通常の加水分解反応の条件にしたがってエステルを酸加水分解あるいは

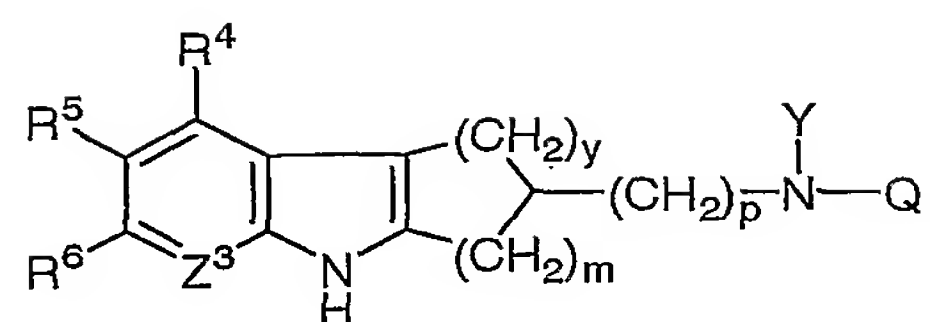
アルカリ加水分解することにより得ることができる。

上記の式 (I I e) で表される化合物は、特開平 8 - 1 6 9 8 7 9 等に記載の方法に従って合成することができる。

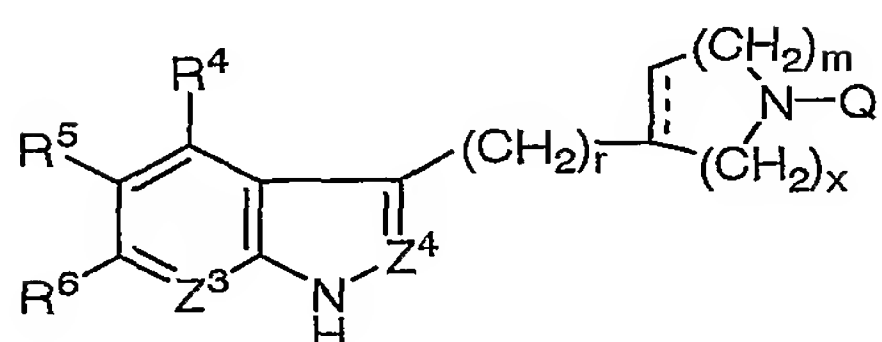
また、上記の式 (I I a) ~ (I I k) で表される化合物は、以下に示す式 (I
5 I I a) ~ (I I I k) で表される化合物のいずれかを出発原料として製造することができる。



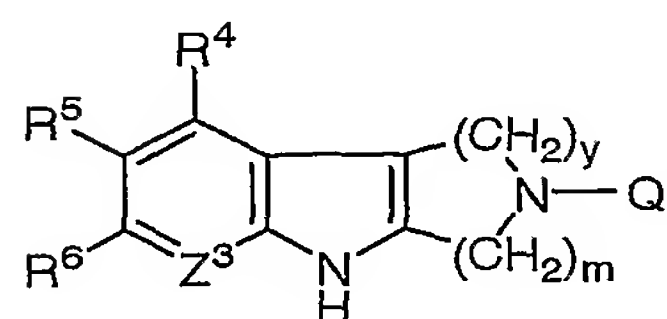
(IIIa)



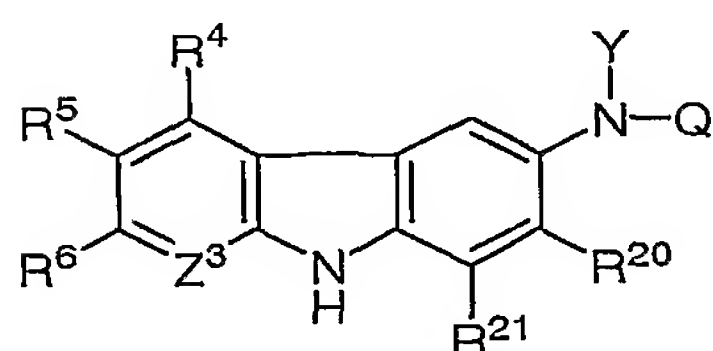
(IIIb)



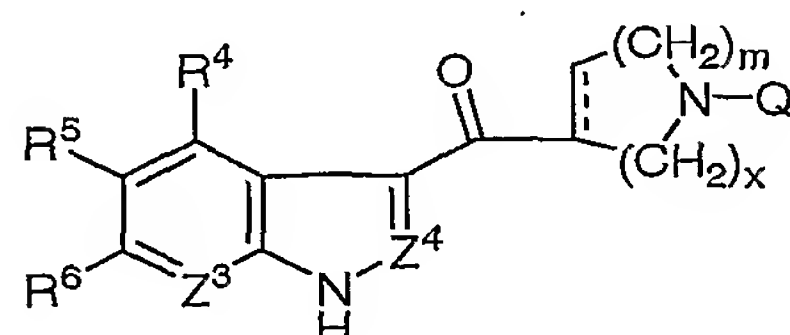
(IIIc)



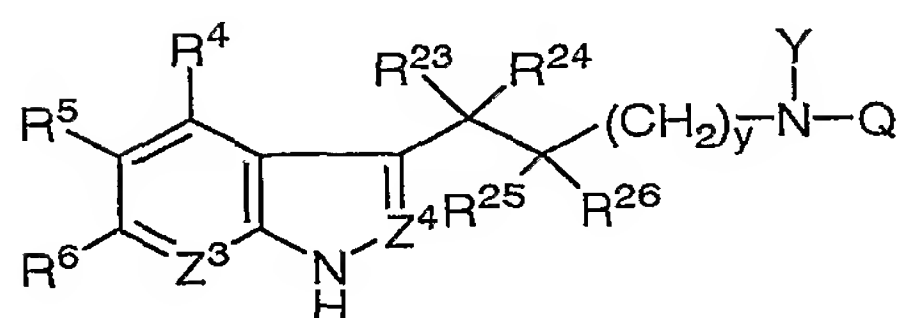
(III d)



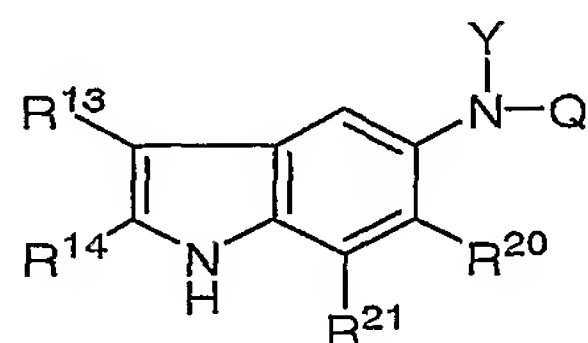
(IIIe)



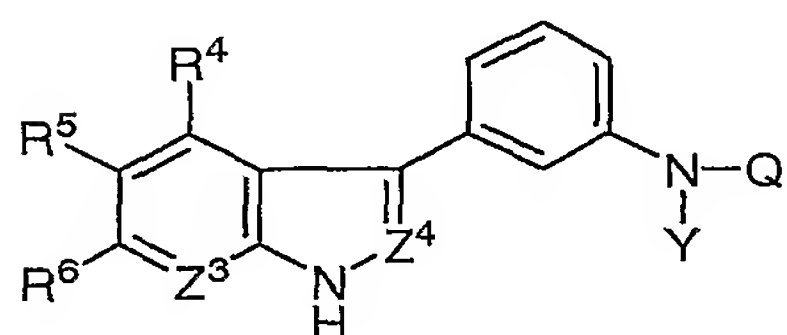
(III f)



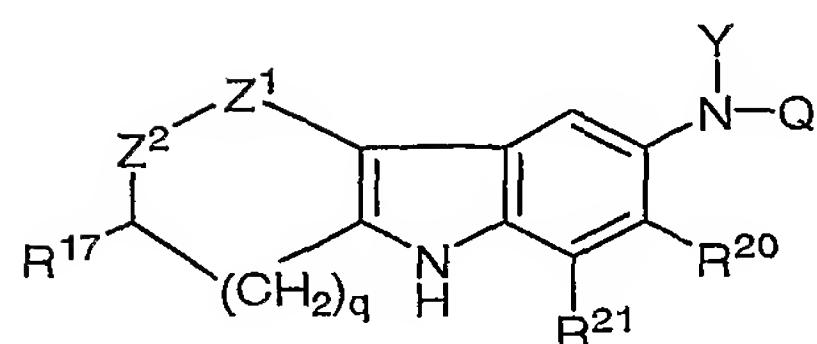
(IIIg)



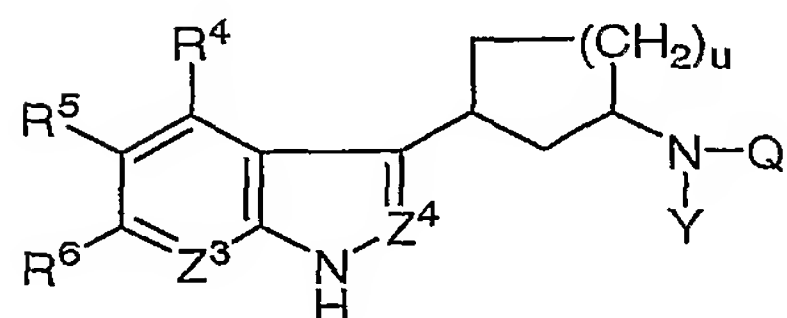
(IIIh)



(IIIi)



(IIIj)



(IIIk)

[式中、各記号はI)の定義と同意義；Qは水素]

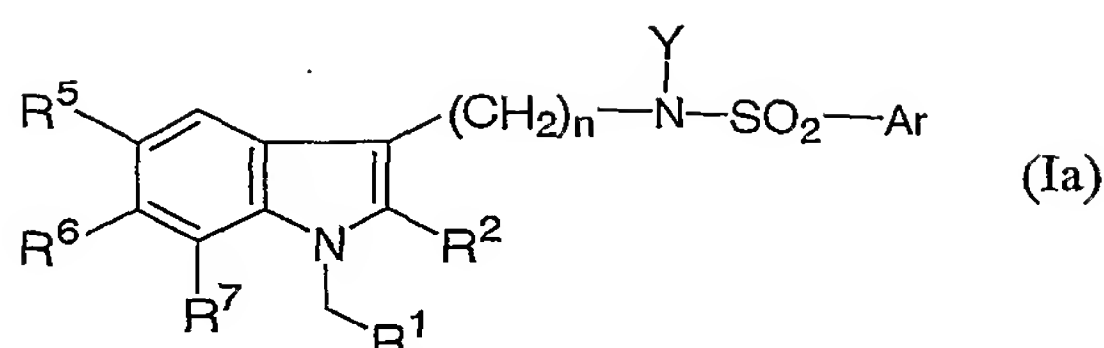
すなわち、以下の1)～3)の工程を行うことにより、式(IIIa)～(IIIk)

k) で表される化合物あるいは塩酸、硫酸等の無機酸、または酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸との塩として製造することができる；1) Qが水素である式(I I I a) ~ (I I I k) で表される化合物のアミノ基を、PROTECTIVE GROUP IN ORGANIC SYNTHESIS、JOHN WILEY & SONS, INC. 等に記載の方法により *t*-ブトキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、アリルオキシカルボニル等のアミノ基の保護基で保護する、2) 得られた化合物を、1~5当量の $X^1-CH_2CO_2R^{12}$ (式中、 X^1 はハロゲン； R^{12} はアルキル) で表される化合物と、ピリジン、アセトニトリル、塩化メチレン、THF、DMF、DMSO、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンなどの不活性溶媒中、1当量から5当量の水素化ナトリウム、水素化カリウム、*t*-ブトキシカリウム、炭酸カリウム等の塩基存在下、0℃から100℃、1時間から20時間反応することにより、インドールの窒素をアルキルオキシカルボニルメチル化する[0.1当量から1当量の相関移動触媒、例えば、塩化テトラブチルアンモニウム、臭化化テトラブチルアンモニウム、ヨウ化テトラブチルアンモニウム、塩化ベンジルトリエチルアンモニウム、塩化ベンジルトリブチルアンモニウム等を加えてもよい]、3) 通常の脱保護条件下、アミノ基の保護基であるQを除去する。

式(I I I c) ならびに(I I I d) で表される化合物、およびYが水素ではない式(I I I a)、(I I I b)、ならびに(I I I e) で表される化合物を、アミノ基を保護することなく、上記スルホニル化を行なった後、インドール窒素をアルキルオキシカルボニルメチル化し、式(I) で表される化合物へと導くことも可能である。

式(I) で表される化合物は、TXA₂受容体拮抗活性を有さない選択的CRTH2受容体拮抗化合物である。そのような化合物として、特に以下に示す式(I a) ~ 式(I e) で表される化合物が好ましい。

式(I a) :



[式中、 R^1 はカルボキシまたは置換されていてもよいアミノカルボニル；

R^2 は水素またはアルキル；

R^5 、 R^6 および R^7 はそれぞれ独立して水素、ハロゲン、アルキル、または式：

5 $-OR^{11}$ （式中、 R^{11} はアルキル）で示される基；

Yは水素、アルキル、アルケニル、フェニル、置換基群Aにより1または2ヶ所

以上置換されていてもよいフェニルアルキル、置換基群Aにより1または2ヶ所

以上置換されていてもよいナフチルアルキル、または置換基群Aにより1または

2ヶ所以上置換されていてもよいチエニルアルキル（置換基群A：アルキル、ア

10 ルキルオキシ、およびニトロ）；

Arは置換基群Bにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいフェニル、置

換基群Bにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいビフェニル、置換基群

Bにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいチエニル、または置換基群B

により1または2ヶ所以上置換されていてもよいジベンゾチエニル（置換基群

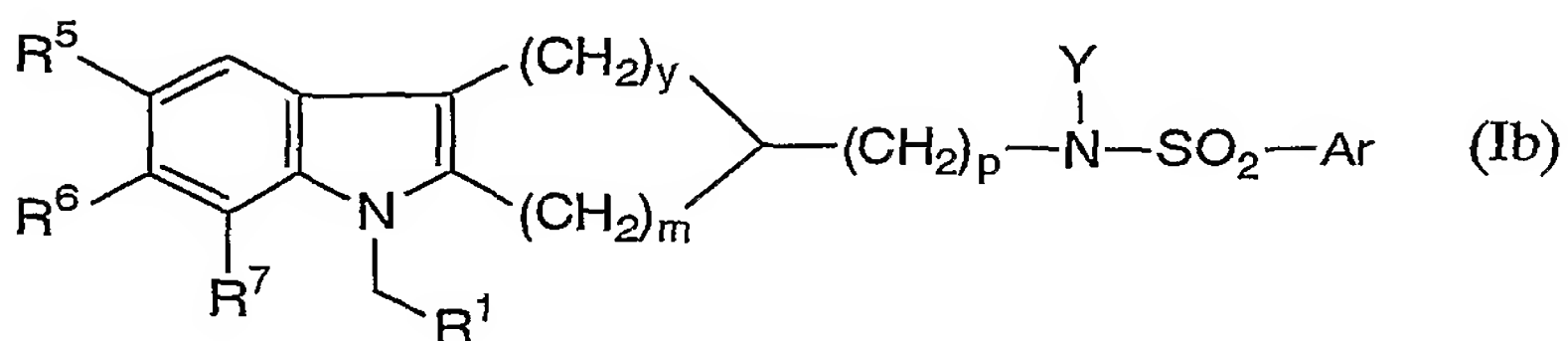
15 B：アルキル、アルキルオキシ、アリールオキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、およ

びベンジル）；および

nは1、2、または3]で示される化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上

許容される塩またはそれらの溶媒和物。

式（Ib）：



[式中、 R^1 はカルボキシまたは置換されていてもよいアミノカルボニル；

R^5 、 R^6 および R^7 はそれぞれ独立して水素、ハロゲン、アルキル、または式：

20 $-OR^{11}$ （式中、 R^{11} はアルキル）で示される基；

Yは水素、アルキル、アルケニル、フェニル、置換基群Aにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいフェニルアルキル、置換基群Aにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいナフチルアルキル、または置換基群Aにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいチエニルアルキル（置換基群A：アルキル、アルキルオキシ、およびニトロ）；

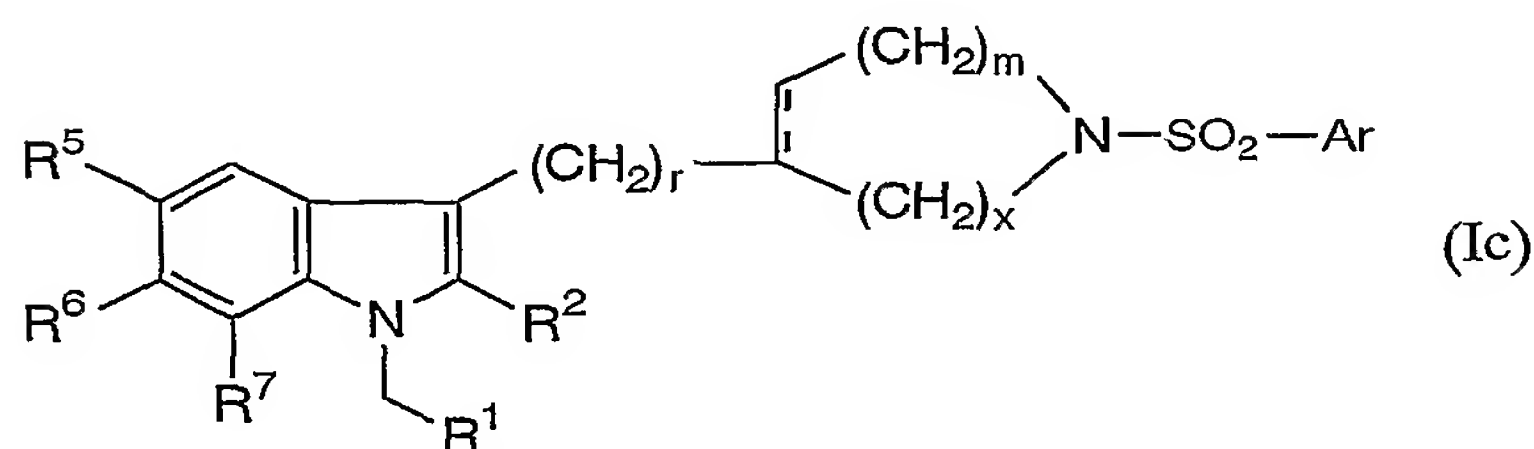
Arは置換基群Aにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいフェニル、置換基群Aにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいビフェニル、置換基群Aにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいチエニル、または置換基群Aにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいジベンゾチエニル（置換基群A：ハロゲン、アルキル、アルキルオキシ、アリールオキシ、ヒドロキシ、およびベンジル）；

mは1または2；

pは0または1；および

yは0、1または2]で示される化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

式(Ic)：



[式中、R¹はカルボキシまたは置換されていてもよいアミノカルボニル；

R²は水素またはアルキル；

R⁵、R⁶およびR⁷はそれぞれ独立して水素、ハロゲン、アルキル、または式：
-OR¹¹（式中、R¹¹はアルキル）で示される基；

Arは置換基群Bにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいフェニル、置換基群Bにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいビフェニル、置換基群Bにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいチエニル、または置換基群B

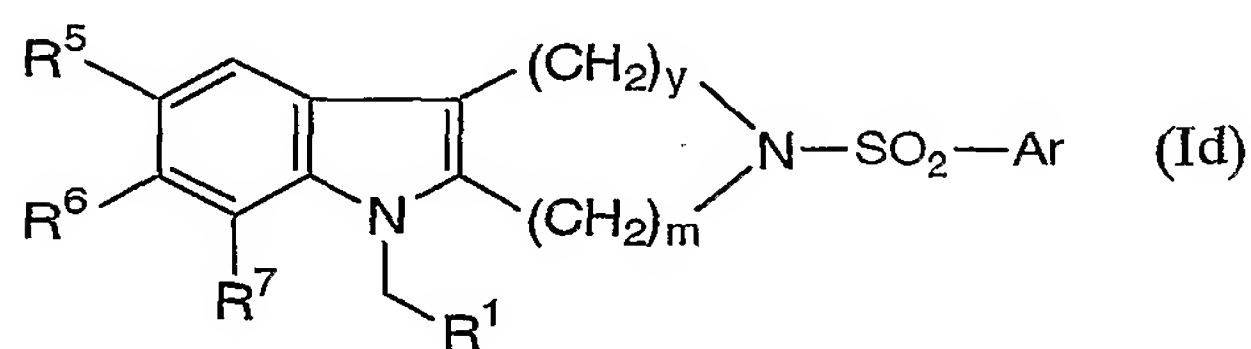
により 1 または 2 ケ所以上置換されていてもよいジベンゾチエニル（置換基群 B：アルキル、アルキルオキシ、アリールオキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、およびベンジル）；

m は 1、2 または 3；

5 r は 0 または 1；および

x は 0、1 または 2] で示される化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

式 (I d)：



10 [式中、R¹はカルボキシまたは置換されていてもよいアミノカルボニル；

R⁵、R⁶およびR⁷はそれぞれ独立して水素、ハロゲン、アルキル、または式：
-OR¹¹（式中、R¹¹はアルキル）で示される基；

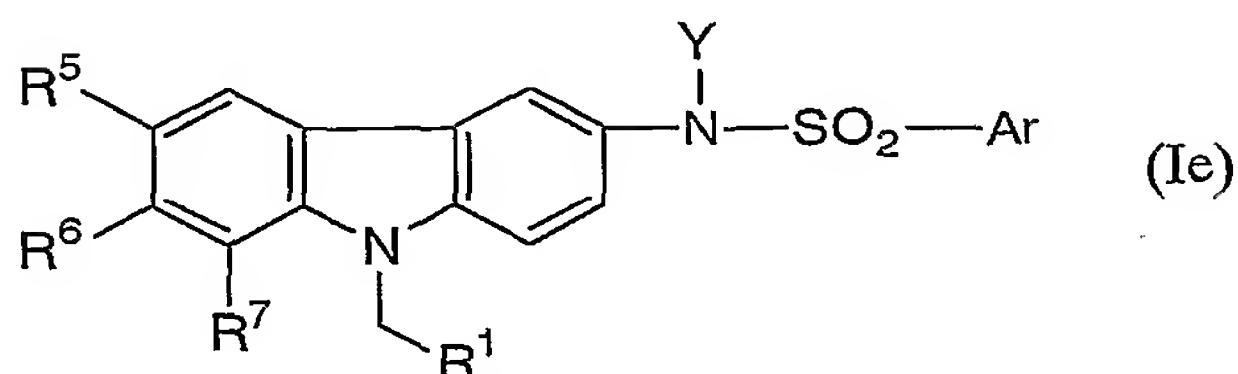
Arは置換基群Bにより1または2ケ所以上置換されていてもよいフェニル、置換基群Bにより1または2ケ所以上置換されていてもよいビフェニル、置換基群

15 Bにより1または2ケ所以上置換されていてもよいチエニル、または置換基群Bにより1または2ケ所以上置換されていてもよいジベンゾチエニル（置換基群 B：アルキル、アルキルオキシ、アリールオキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、およびベンジル）；

m は 1 または 2；および

20 y は 1 または 2] で示される化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

式 (I e)：



[式中、 R^1 はカルボキシまたは置換されていてもよいアミノカルボニル；

R^5 、 R^6 および R^7 はそれぞれ独立して水素、ハロゲン、アルキル、または式：
—OR¹¹（式中、 R^{11} はアルキル）で示される基；

Yは水素、アルキル、アルケニル、フェニル、置換基群Aにより1または2ヶ所
5 以上置換されていてもよいフェニルアルキル、置換基群Aにより1または2ヶ所
以上置換されていてもよいナフチルアルキル、または置換基群Aにより1または
2ヶ所以上置換されていてもよいチエニルアルキル（置換基群A：アルキル、ア
ルキルオキシ、およびニトロ）；および

A_rは置換基群Bにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいフェニル、置
10 換基群Bにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいビフェニル、置換基群
Bにより1または2ヶ所以上置換されていてもよいチエニル、または置換基群B
により1または2ヶ所以上置換されていてもよいジベンゾチエニル（置換基群
B：アルキル、アルキルオキシ、アリールオキシ、ハロゲン、ヒドロキシ、およ
びベンジル）]で示される化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容され
15 る塩またはそれらの溶媒和物。

本明細書中、「溶媒和物」とは、例えば有機溶媒との溶媒和物、水和物等を包
含する。有機溶媒との溶媒和物を形成する時は、任意の数の有機溶媒分子と配位
していてもよい。水和物を形成する時は、任意の数の水分子と配位していてもよ
い。水和物が好ましい。

20 「本発明化合物」という場合には、製薬上許容される塩、またはその溶媒和物も
包含される。例えば、アルカリ金属（リチウム、ナトリウム、カリウム等）、アル
カリ土類金属（マグネシウム、カルシウム等）、アンモニウム、有機塩基およびア
ミノ酸との塩、または無機酸（塩酸、臭化水素酸、リン酸、硫酸等）、および有機
酸（酢酸、クエン酸、マレイン酸、フマル酸、ベンゼンスルホン酸、パラトルエン
25 スルホン酸等）との塩が挙げられる。これらの塩は、通常行われる方法によって形
成させることができる。

プロドラッグは、化学的または代謝的に分解できる基を有する本発明化合物の

誘導体であり、加溶媒分解によりまたは生理学的条件下でインビボにおいて薬学的に活性な本発明化合物となる化合物である。適当なプロドラッグ誘導体を選択する方法および製造する方法は、例えば *Design of Prodrugs*, Elsevier, Amsterdam 1985 に記載されている。本発明化合物がカルボキシル基を有する場合は、もとになる酸性化合物と適当なアルコールを反応させることによって製造されるエステル誘導体、またはもとになる酸性化合物と適当なアミンを反応させることによって製造されるアミド誘導体のようなプロドラッグが例示される。プロドラッグとして特に好ましいエステルとしては、メチルエステル、エチルエステル、*n*-プロピルエステル、イソプロピルエステル、*n*-ブチルエステル、イソブチルエステル、*tert*-ブチルエステル、モルホリノエチルエステル、*N*, *N*-ジエチルグリコールアミドエステル等が挙げられる。本発明化合物がヒドロキシル基を有する場合は、例えばヒドロキシル基を有する化合物と適当なアシルハライドまたは適当な酸無水物とを反応させることに製造されるアシルオキシ誘導体のようなプロドラッグが例示される。プロドラッグとして特に好ましいアシルオキシとしては、 $-\text{OCCOC}_2\text{H}_5$ 、 $-\text{OCCO}$ (*t*-Bu)、 $-\text{OCCOC}_{15}\text{H}_{31}$ 、 $-\text{OCCO}$ (*m*-COONa-Ph)、 $-\text{OCCOCH}_2\text{CH}_2\text{COONa}$ 、 $-\text{OCCOCH}(\text{NH}_2)\text{CH}_3$ 、 $-\text{OCCOCH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 等が挙げられる。本発明化合物がアミノ基を有する場合は、アミノ基を有する化合物と適当な酸ハロゲン化物または適当な混合酸無水物とを反応させることにより製造されるアミド誘導体のようなプロドラッグが例示される。プロドラッグとして特に好ましいアミドとしては、 $-\text{NHCO}(\text{CH}_2)_{20}\text{CH}_3$ 、 $-\text{NHCOCH}(\text{NH}_2)\text{CH}_3$ 等が挙げられる。

また、本発明化合物は特定の異性体に限定するものではなく、全ての可能な異性体やラセミ体を含むものである。

本発明化合物は後述する実験例の記載の通り、優れた CRTH2 受容体拮抗作用を示す。したがって、本発明医薬組成物は、好酸球が関与していると考えられるアレルギー性疾患、例えば喘息、アレルギー性鼻炎、アレルギー性皮膚炎、丘

疹性皮膚炎（糸状虫症など）、脈管炎、多発性動脈炎、皮膚好酸性肉芽腫、自己免疫疾患（例えば多発性硬化症、移植片拒絶など）、好酸球性肺症、組織球増殖症（Histiocytosis）、肺炎、肺糸子菌（アスペルギルス）症、胸膜炎、サルコイドーシス、特発性肺線維症、好酸球増多症、フィラリア症、住血吸虫症、旋毛虫症、コクシジオイデス症、結核、気管支癌、リンパ腫、ホジキン病等の疾患の予防および／または治療剤として使用しうる。

本発明化合物を、上記の疾患の治療を目的としてヒトに投与する場合は、散剤、顆粒剤、錠剤、カプセル剤、丸剤、液剤等として経口的に、または注射剤、坐剤、経皮吸収剤、吸入剤等として非経口的に投与することができる。また、本化合物の有効量にその剤型に適した賦形剤、結合剤、湿潤剤、崩壊剤、滑沢剤等の医薬用添加剤を必要に応じて混合し、医薬製剤とすることができる。注射剤の場合には、適当な担体と共に滅菌処理を行って製剤とする。

投与量は疾患の状態、投与ルート、患者の年齢、または体重によっても異なるが、成人に経口で投与する場合、通常 $0.1 \sim 100 \text{ mg/kg/日}$ であり、好ましくは $1 \sim 20 \text{ mg/kg/日}$ である。

実施例

以下に実施例および試験例を挙げて本発明をさらに詳しく説明するが、本発明はこれらにより限定されるものではない。

実施例中、以下の略号を使用する。

Me : メチル

Et : エチル

iPr : イソプロピル

Ph : フェニル

Boc : t-ブトキシカルボニル

THF : テトラヒドロフラン

MeOH : メタノール

n a p h t h y l : ナフチル

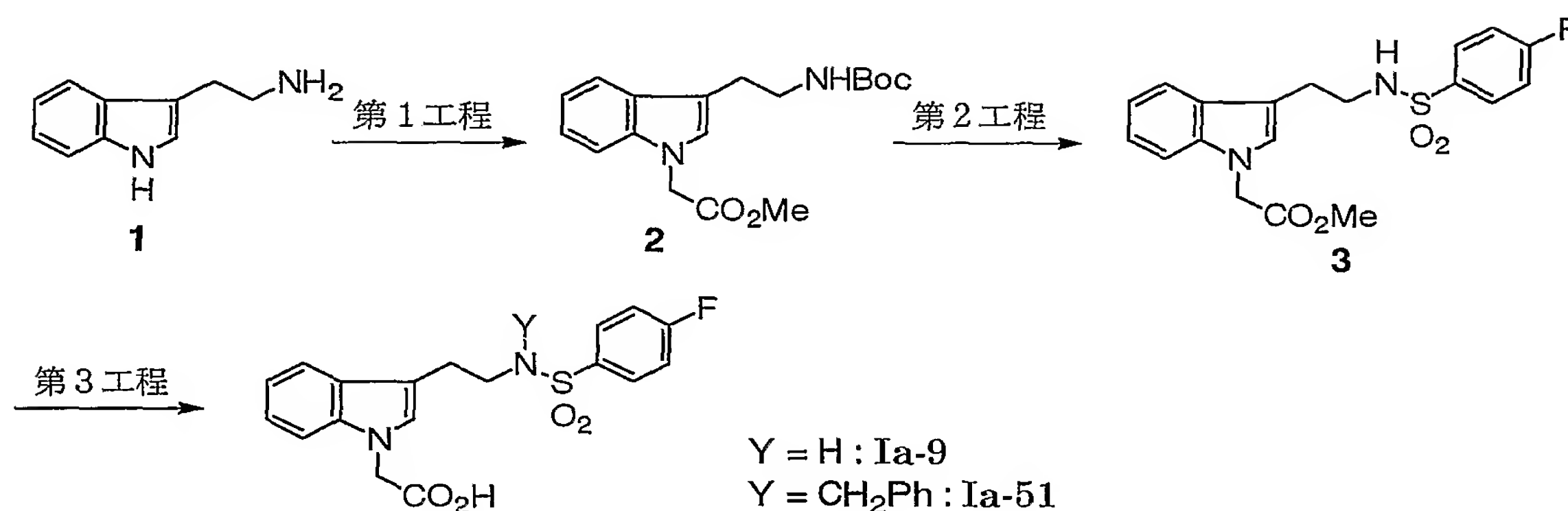
B e n z y l : ベンジル

T h i e n y l : チエニル

B i p h e n y l : ビフェニル

5 D i b e n z o t h i o p h e n e : ジベンゾチオフェン

実施例 1 化合物 Ia-9、化合物 Ia-51



10 第1工程

トリプタミン (1) (20 g、0.125 mol) のジオキサン (160 mL) - 水 (80 mL) 溶液に、氷冷下、炭酸ナトリウム (39.7 g、0.374 mol) と二炭酸ジ-tert-ブチル (31.5 mL、0.137 mol) のジオキサン (20 mL) 溶液を加え、2.5時間攪拌した。反応混合物に2 mol / L塩酸を加えた後、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄、乾燥、濃縮し、42.49 gの残渣を得た。このうち7.0 gをメチルエチルケトン (150 mL) に溶解し、炭酸カリウム (11.15 g、80.7 mmol)、ブromo酢酸メチル (10.2 mL、0.108 mol) を加え、48時間加熱還流した。酢酸エチルで希釈し、希塩酸、炭酸水素ナトリウム水溶液で順次洗浄、乾燥、濃縮後、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル、2:1) で精製し、化合物 (2) (4.57 g; 収率51%) を得た。

第2工程

化合物 (2) (1.5 g、4.5 mmol) の塩化メチレン (10 mL) 溶液に、トリフルオロ酢酸 (10 mL) を加え、室温で 10 分間攪拌した。反応混合物を減圧濃縮した後、2 mol/L 炭酸ナトリウム水溶液で中和し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、乾燥、濃縮し、983 mg の残渣を得た。このうち 120 mg を塩化メチレン (3 mL) 溶液に溶解し、トリエチルアミン (0.108 mL、0.775 mmol)、塩化 4-フルオロベンゼンスルホン (121 mg、0.622 mmol) を加え、室温で 2 時間攪拌した。酢酸エチルで希釈し、希塩酸、炭酸水素ナトリウム水溶液で順次洗浄、乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル、3:2) で精製し、化合物 (3) (99 mg; 収率 46%) を得た。

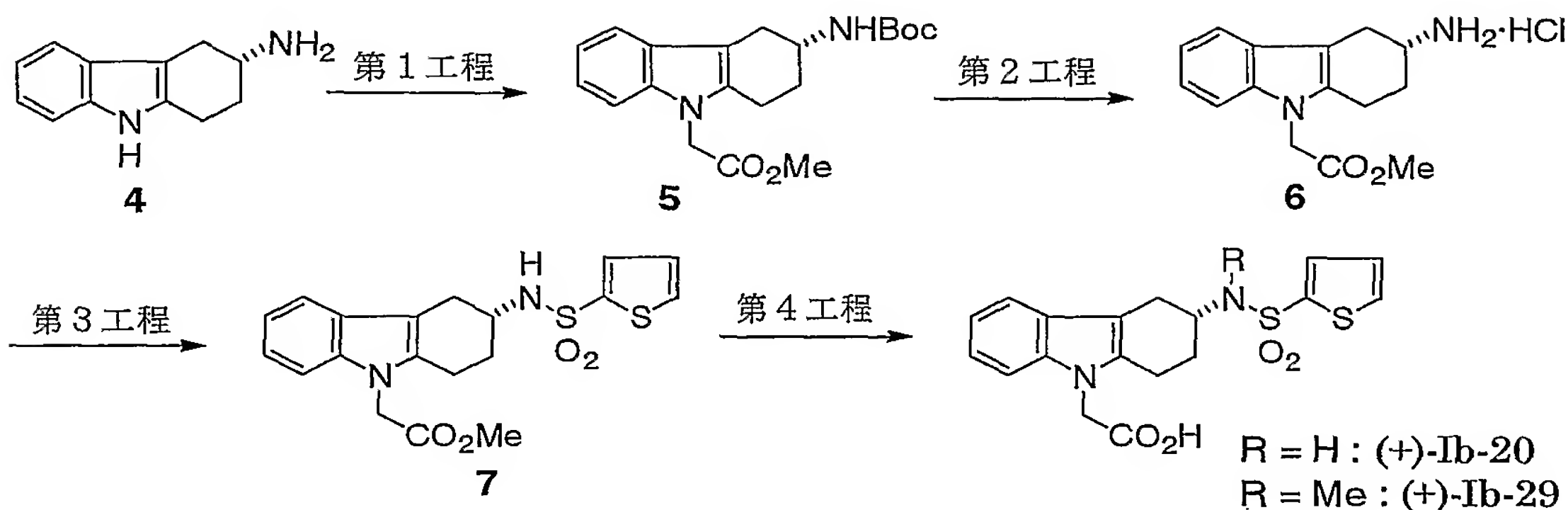
第 3 工程

化合物 (3) (99 mg、0.254 mmol) の MeOH (1.5 mL) - THF (1.5 mL) 溶液に 2 mol/L 水酸化ナトリウム溶液 (0.76 mL、1.52 mmol) を加え、室温で 5.5 時間攪拌した。希塩酸を加え酸性とした後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水および飽和食塩水で洗浄、乾燥、濃縮し、化合物 Ia-9 (79 mg; 収率 83%) を得た。物理恒数は表 12 に示す。

第 4 工程

化合物 (3) (132 mg、0.339 mmol) の N, N-ジメチルホルムアミド (2 mL) 溶液に、臭化ベンジル (48 μ L、0.407 mmol)、炭酸カリウム (70 mg、0.509 mmol) を加え、50 °C で 21.5 時間攪拌した。反応混合物を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出、有機層を飽和食塩水で洗浄、乾燥、濃縮した。残渣を MeOH (2 mL) - THF (2 mL) に溶解し、2 mol/L 水酸化ナトリウム溶液 (1.1 mL、2.2 mmol) を加え、室温で 5 時間攪拌した。水で希釈し、エーテルで洗浄した後、水層に希塩酸を加え酸性とし、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で洗浄、乾燥、濃縮し、化合物 Ia-51 (175 mg; 収率 99%) を得た。物理恒数は以下の表に示す。

実施例 2 化合物 I b-20、化合物 I b-29



5 第 1 工程

特開昭 62-198659 に記載されている (3R)-3-アミノ-1,2,3,4-テトラヒドロカルバゾール (4) (3.33 g、17.9 mmol) の 1,4-ジオキサン (33 mL) 溶液に二炭酸ジ-*tert*-ブチル (4.1 g、18.8 mmol) を加え室温で 2 時間攪拌した。減圧濃縮し得られた残渣をメチルエチルケトン (52 mL) に溶解し、炭酸カリウム (4.52 g、32.7 mmol)、塩化ベンジルトチエチルアンモニウム (0.74 g、3.26 mmol)、ブromo酢酸メチル (5.00 g、32.7 mmol) を加え 4 時間加熱還流した。不溶物を濾過し減圧濃縮、残渣を酢酸エチルで希釈し水洗、乾燥、濃縮した。残渣をヘキサン-エーテルから結晶化し、化合物 (5) (4.36 g; 収率 68%、融点 127-130°C) を得た。

第 2 工程

化合物 (5) (4.25 g、11.9 mmol) の酢酸エチル (12 mL) 溶液に 4 mmol/L 塩酸-酢酸エチル溶液 (12 mL、48.0 mmol) を加え、室温で 2 時間攪拌した。析出した結晶を濾過、酢酸エチルで洗浄し化合物 (6) (3.44 g、収率 98%) を得た。

第 3 工程

化合物 (6) (295 mg、1.0 mmol) の THF (6 mL) 溶液にトリ

エチルアミン (0.30 g、3.0 mmol)、塩化2-チオフェンスルホニル
(296 mg、1.62 mmol)を加え、室温で16時間攪拌した。反応液を
水で希釈し、酢酸エチルで抽出、有機層を希塩酸、水で洗浄、硫酸マグネシウム
で乾燥、濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (ヘキサンー
5 酢酸エチル、1 : 1) で精製し、化合物 (7) (379 mg; 収率94%) を得
た。

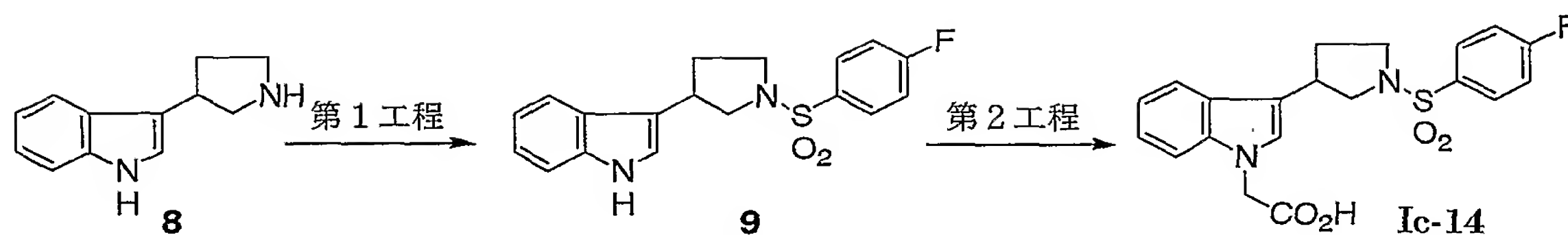
第4工程

化合物 (7) (371 mg、0.917 mmol) の MeOH (1.2 mL)
ー THF (1.2 mL) 溶液に、4 mmol/L 水酸化ナトリウム水溶液 (0.6
10 mL、2.4 mmol) を加え、室温で2時間攪拌した。反応液を水で希釈し、
希塩酸を加え酸性とした後、酢酸エチルで抽出し、抽出液を水で洗浄した。硫酸
マグネシウムで乾燥、減圧濃縮し、化合物 (+) - Ib - 20 (343 mg; 収
率91%) を得た。

第5工程

15 化合物 (7) (243 mg、0.622 mmol) のジメチルホルムアミド (2
mL) 溶液に、炭酸カリウム (0.26 g、1.87 mmol)、ヨウ化メチル
(0.27 g、1.90 mmol) を加え、室温で2.5時間攪拌した。反応液
を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄、乾燥、減圧濃縮した後、MeOH (1 mL)
ー THF (1 mL) に溶解した。4 mmol/L 水酸化ナトリウム水溶液 (0.4
20 mL、1.6 mmol) を加え、室温で3時間攪拌した。反応液を水で希釈し、
希塩酸を加え酸性とした後、酢酸エチルで抽出、抽出液を水で洗浄、乾燥、濃縮
した。得られた残渣をヘキサンー酢酸エチルから結晶化し、化合物 (+) - Ib
ー 29 (217 mg; 収率88%) を得た。物理恒数は以下の表に示す。

25 実施例3 化合物 Ic - 14



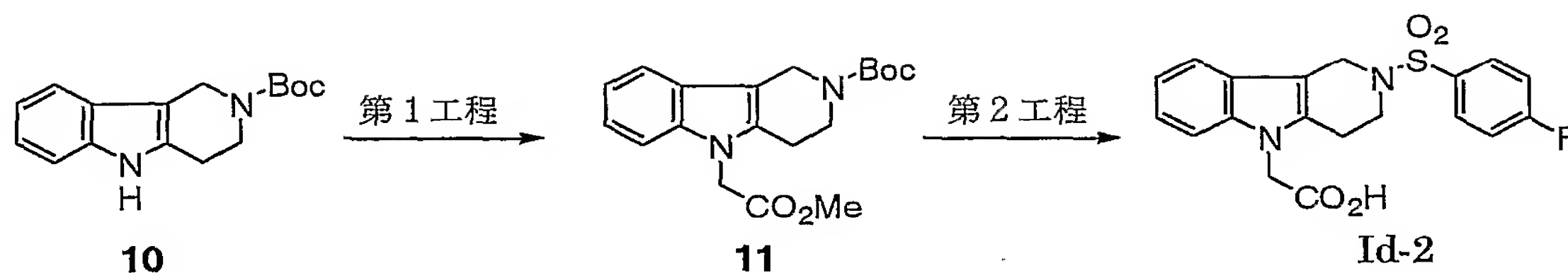
第 1 工程

化合物 (8) (610 mg、3.28 mmol、シンセシス、443 (199
 5 7) に記載) の THF (6 mL) 溶液にトリエチルアミン (0.50 g、4.9
 2 mmol)、塩化 4-フルオロベンゼンスルホニル (0.70 g、3.60 m
 mol) を加え、室温で 1.5 時間攪拌した。反応液を水で希釈し、酢酸エチル
 で抽出、有機層を希塩酸、水で順次洗浄、乾燥、濃縮した。得られた残渣をシリ
 カゲルクロマトグラフィー (トルエン-酢酸エチル、5 : 1) で精製し、化合物
 10 (9) (856 mg ; 収率 76%) を得た。

第 2 工程

化合物 (9) (800 mg、2.32 mmol) のメチルエチルケトン (8 m
 L) 溶液に、炭酸カリウム (0.96 g、6.96 mmol)、塩化ベンジルト
 チエチルアンモニウム (106 mg、0.464 mmol)、ブromo酢酸メチル
 15 (1.06 g、6.96 mmol) を加え 2.5 時間加熱還流した。反応液を水
 で希釈し、トルエンで抽出、抽出液を水で洗浄、乾燥、濃縮した。得られた残渣
 をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン-酢酸エチル、5 : 1) で精製した。
 生成物を MeOH (2.8 mL) - THF (1.4 mL) に溶解した。4 mmol
 /L 水酸化ナトリウム水溶液 (1.4 mL、5.6 mmol) を加え、室温で 2
 20 時間攪拌した。反応液を水で希釈し希塩酸を加え酸性とした後、酢酸エチルで抽
 出し、抽出液を水で洗浄、乾燥、濃縮した。残渣をヘキサン-酢酸エチルから結
 晶化し、化合物 Ic-14 (717 mg ; 収率 79%) を得た。物理恒数は以下の
 の表に示す。

25 実施例 4 化合物 Id-2



第1工程

ジャーナル オブ オーガニックケミストリー 62 2676 (1997)

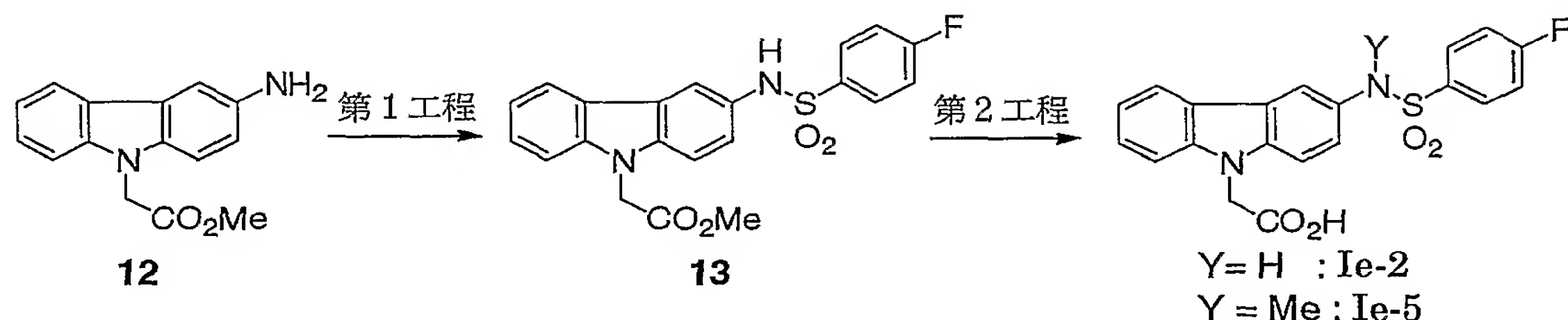
5 に記載の方法に準じて調製した化合物(10) (1.25 g、4.59 mmol) のメチルエチルケトン (20 mL) 溶液に、炭酸カリウム (1.9 g、13.7 mmol)、ブromo酢酸メチル (1.74 mL、18.36 mmol)、塩化ベンジルトリエチルアンモニウム (209 mg、0.92 mmol) を加え、20時間加熱還流した。酢酸エチルで希釈し、水、飽和食塩水で順次洗浄、乾燥、濃縮後、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル、3:1) で精製し、化合物(11) (1.18 g; 収率75%)を得た。

第2工程

化合物(11) (355 mg、1.03 mmol) のエーテル (0.5 mL) 溶液に、4 mmol/L 塩酸-酢酸エチル溶液 (2.06 mL, 8.24 mmol) を加え、室温で3時間攪拌した。析出した塩酸塩をろ過、エーテルで洗浄し、THF (3 mL) に溶解した。この溶液にトリエチルアミン (0.37 mL、2.66 mmol)、塩化4-フルオロベンゼンスルホン (365 mg、1.88 mmol) を加え、室温で16時間攪拌した。酢酸エチルで希釈し、希塩酸、炭酸水素ナトリウム水溶液で順次洗浄、乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル、2:1) で精製した。生成物を MeOH (8 mL) - THF (4 mL) に溶解した。1 mmol/L 水酸化ナトリウム溶液 (1.8 mL、1.8 mmol) を加え、室温で16時間攪拌した。反応混合物を水で希釈し、エーテルで洗浄した。水層に希塩酸を加え、析出した結晶をろ過、水洗、乾燥し、化合物 Id-2 (192 mg; 収率48%)を得た。物理恒数は

25 以下の表に示す。

実施例 5 化合物 I e - 2、化合物 I e - 5



5 第1工程

特開平 8 - 1 6 9 8 7 9 に記載の方法に準じて調製した化合物 (1 2) (5 0 9 m g、2 m m o l) の T H F (1 0 m L) 溶液に、トリエチルアミン (0 . 8 4 m L、6 m m o l)、塩化 4 - フルオロベンゼンスルホニル (5 0 6 m g、2 . 6 m m o l) を加え、室温で 1 9 時間攪拌した。酢酸エチルで希釈し、希塩酸、炭酸水素ナトリウム水溶液で順次洗浄、乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン - 酢酸エチル、4 : 1) で精製し、化合物 (1 3) (7 2 5 m g ; 収率 8 8 %) を得た。

第2工程

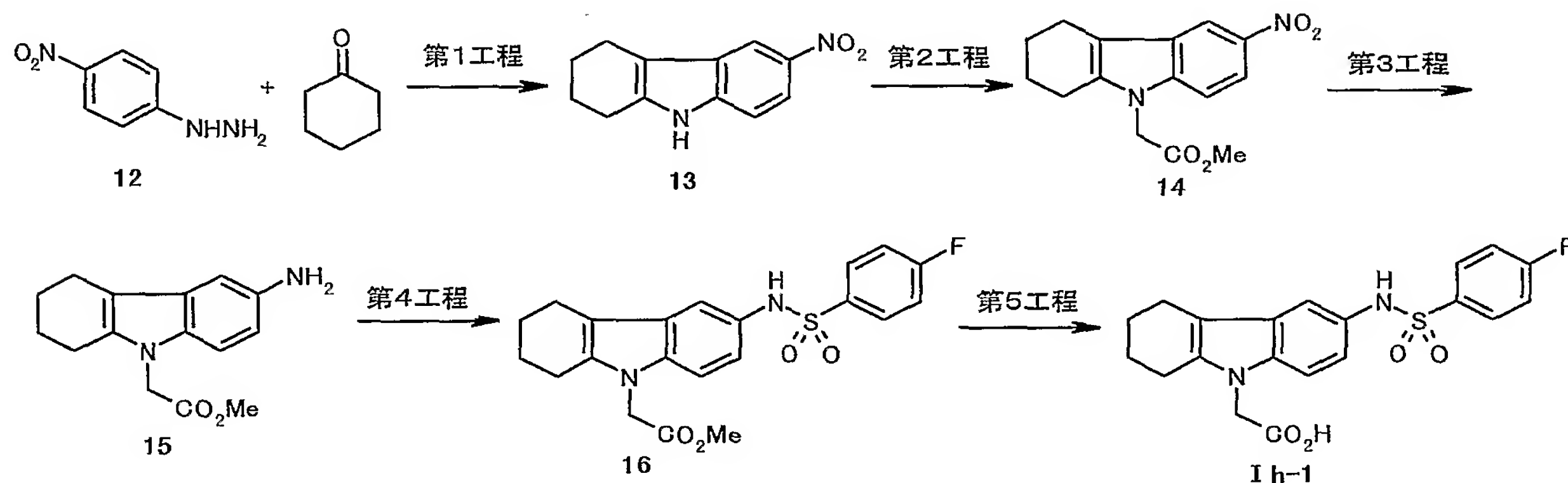
化合物 (1 3) (3 0 9 m g、0 . 7 5 m m o l) の M e O H (6 m L) - T H F (3 m L) 溶液に 1 m o l / L 水酸化ナトリウム溶液 (1 . 9 m L、1 . 9 m m o l) を加え、室温で 2 1 時間攪拌した。希塩酸を加え酸性とした後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水および飽和食塩水で洗浄、乾燥、濃縮した。残渣を酢酸エチル - ヘキサンより結晶化し、化合物 I e - 2 (2 8 7 m g ; 収率 9 6 %) を得た。物理恒数は以下の表に示す。

20 第3工程

化合物 (1 3) (3 6 3 m g、0 . 8 8 m m o l) の N , N - ジメチルホルムアミド (3 . 6 m l) 溶液に、ヨウ化メチル (2 5 0 m g、1 . 7 6 m m o l)、炭酸カリウム (1 8 2 m g、1 . 3 2 m m o l) を加え、室温で 1 9 時間攪拌した。反応混合物を水に注ぎ、酢酸エチル - ヘキサン (1 : 2) で抽出、有機層を

飽和食塩水で洗浄、乾燥、濃縮した。残渣を MeOH-THF (2:1) に溶解し、1 mol/L 水酸化ナトリウム溶液 (1.8 mL、1.8 mmol) を加え、室温で 26 時間攪拌した。水で希釈し、エーテルで洗浄した後、水層に希塩酸を加え酸性とし、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で洗浄、乾燥、濃縮した後、残渣をヘキサンより結晶化し、化合物 Ie-5 (293 mg; 収率 84%) を得た。物理恒数は以下の表に示す。

実施例 6 化合物 Ih-1



第 1 工程

パラニトロフェニルヒドラジン (12) (15.0 g、97.9 mmol) とシクロヘキサノン (10.15 mL、97.9 mmol) の酢酸 (45 mL) 混合液を 60 °C で 20 分加熱攪拌した。次に、反応混合物に濃塩酸を 15 mL 加え、さらに、1 時間 30 分加熱還流した。反応混合物に水を 50 mL 加え、10 分間加熱還流して、室温まで冷却した。析出した結晶をろ過、水でよく洗浄後、エタノール-水から再結晶し 6-ニトロテトラヒドロカルバゾール (13) を 17.0 g (収率 80%) を得た。

第 2 工程

化合物 (13) (6.80 g、31.44 mmol)、ブromo酢酸メチル (8.

93 ml、94.32 mmol)、炭酸カリウム (13 g、94 mmol)、塩
化ベンジルトリエチルアンモニウム (1.43 g、6.28 mmol) のメチル
エチルケトン (100 ml) の混合液を1時間加熱還流した。減圧濃縮し得られ
た残渣を酢酸エチルで希釈し水洗、乾燥、濃縮した。残渣を酢酸エチル-ヘキサ
ンから再結晶し、化合物 (14) (7.93 g; 収率87%) を得た。

第3工程

化合物 (14) (7.92 g、27.47 mmol)、水酸化パラジウム (20%
wt、1.0 g) の THF (70 ml) 及び MeOH (14 ml) の混合液を水
素雰囲気下に、7時間攪拌した。触媒を除いた後、減圧濃縮した。得られた残渣
をシリカゲルクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル、1:1) で精製し、
化合物 (15) (5.89 g; 収率83%) を得た。

第4工程

化合物 (15) (3.89 g、15.0 mmol) の THF (30 ml) 溶液にト
リエチルアミン (4.18 ml、30 mmol)、塩化4-フルオロベンゼンス
ルフォニル (3.07 g、15.8 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。
反応液に希塩酸を加え、酢酸エチルで抽出、有機層を水洗、乾燥、濃縮した。得
られた残渣を酢酸エチル-ヘキサンから結晶化し、化合物 (16) (5.93 g;
収率95%) を得た。

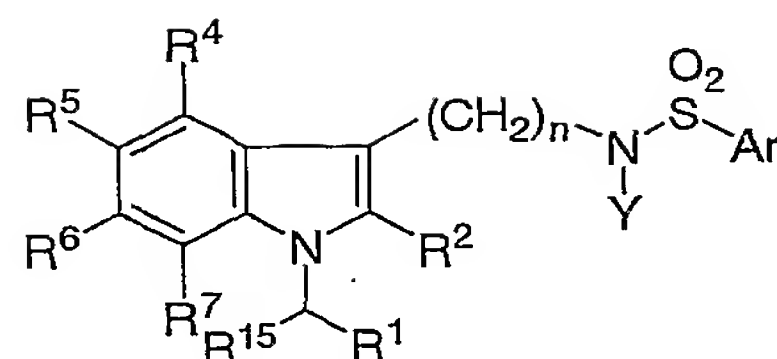
第5工程

化合物 (16) (350 mg、0.84 mmol)、MeOH (4 ml) - TH
F (2 ml) 溶液に2 mmol/L水酸化ナトリウム水溶液 (1 mL、2 mmol)
を加え、室温で15時間攪拌した。反応液に希塩酸を加え、酢酸エチルで抽出し
た。有機層を水洗、乾燥、濃縮した。得られた残渣を酢酸エチル-ヘキサンから
結晶化し、化合物 Ih-1 (268 mg; 収率79%) を得た。物理恒数は以下

の表に示す。

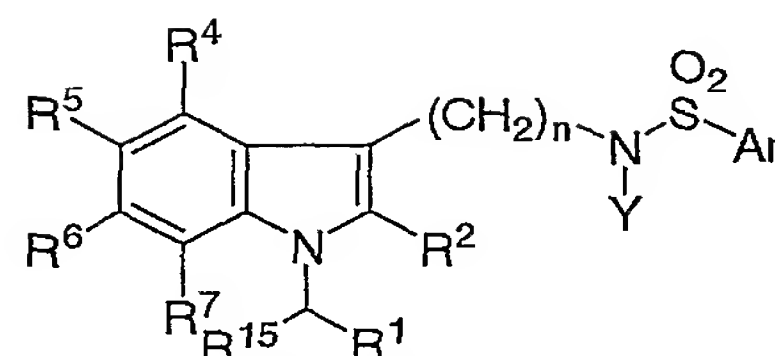
実施例 1 ～ 6 に記載の方法に従って、以下の表に示す化合物を合成することができる。

(表 1)



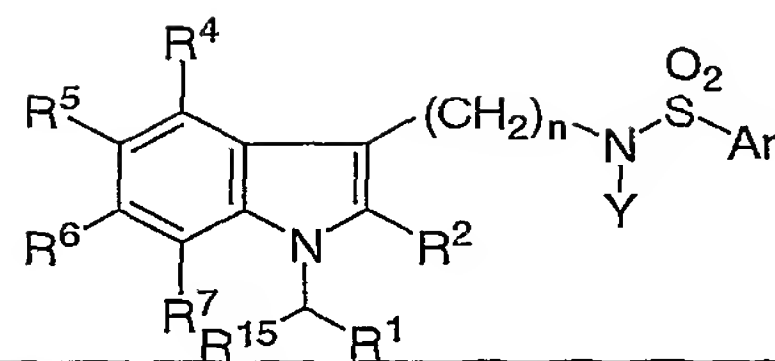
No	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ¹⁵	n	Y	Ar
Ia-1	COOH	H	H	H	H	H	H	1	H	C ₆ H ₅
Ia-2	COOH	H	H	H	H	H	H	1	H	4-F-C ₆ H ₄
Ia-3	COOH	H	H	H	H	H	H	1	Me	C ₆ H ₅
Ia-4	COOH	H	H	H	H	H	H	1	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ia-5	COOH	H	H	H	H	H	H	1	CH ₂ C ₆ H ₅	C ₆ H ₅
Ia-6	COOH	H	H	H	H	H	H	1	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ia-7	COOH	H	H	H	H	H	H	2	H	C ₆ H ₅
Ia-8	COOH	H	H	H	H	H	H	2	H	2-F-C ₆ H ₄
Ia-9	COOH	H	H	H	H	H	H	2	H	4-F-C ₆ H ₄
Ia-10	COOH	H	H	H	H	H	H	2	H	2-Me-C ₆ H ₄
Ia-11	COOH	H	H	H	H	H	H	2	H	4-Me-C ₆ H ₄
Ia-12	COOH	H	H	H	H	H	H	2	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ia-13	COOH	H	H	H	H	H	H	2	H	2-thienyl
Ia-14	COOH	H	H	H	H	H	H	2	H	3-thienyl
Ia-15	COOH	H	H	H	H	H	H	2	H	4-F-biphenyl
Ia-16	COOH	H	H	H	H	H	H	2	H	C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₅
Ia-17	COOH	H	H	H	H	H	H	2	H	dibenzothiophene-3-yl
Ia-18	COOH	Me	H	H	H	H	H	2	H	C ₆ H ₅
Ia-19	COOH	Me	H	H	H	H	H	2	H	2-F-C ₆ H ₄
Ia-20	COOH	Me	H	H	H	H	H	2	H	4-F-C ₆ H ₄
Ia-21	COOH	Me	H	H	H	H	H	2	H	2-thienyl
Ia-22	COOH	Me	H	H	H	H	H	2	H	3-thienyl
Ia-23	COOH	H	H	H	H	Me	H	2	H	C ₆ H ₅
Ia-24	COOH	H	H	H	H	Me	H	2	H	2-F-C ₆ H ₄
Ia-25	COOH	H	H	H	H	Me	H	2	H	4-F-C ₆ H ₄

(表 2)



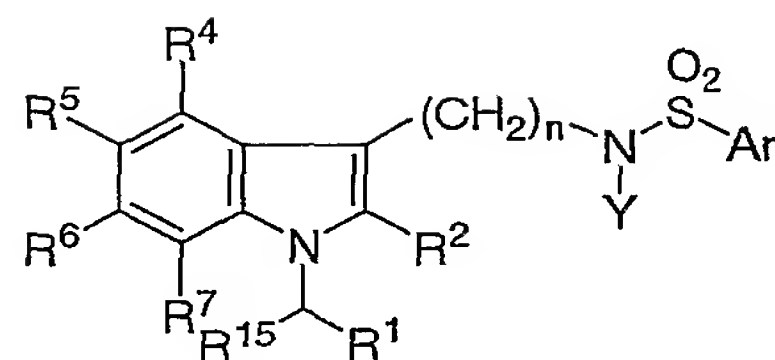
No	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ¹⁵	n	Y	Ar
Ia-26	COOH	H	H	H	H	Me	H	2	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ia-27	COOH	H	H	H	H	Me	H	2	H	3-thienyl
Ia-28	COOH	H	H	OMe	H	H	H	2	H	4-F-C ₆ H ₄
Ia-29	COOH	H	H	OMe	H	H	H	2	H	2-thienyl
Ia-30	COOH	H	H	Cl	H	H	H	2	H	C ₆ H ₅
Ia-31	COOH	H	H	Cl	H	H	H	2	H	2-F-C ₆ H ₄
Ia-32	COOH	H	H	Cl	H	H	H	2	H	4-F-C ₆ H ₄
Ia-33	COOH	H	H	Cl	H	H	H	2	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ia-34	COOH	H	H	F	H	H	H	2	H	C ₆ H ₅
Ia-35	COOH	H	H	F	H	H	H	2	H	2-F-C ₆ H ₄
Ia-36	COOH	H	H	F	H	H	H	2	H	4-F-C ₆ H ₄
Ia-37	COOH	H	H	H	F	H	H	2	H	4-F-C ₆ H ₅
Ia-38	COOH	H	H	H	H	H	H	2	Me	C ₆ H ₅
Ia-39	COOH	H	H	H	H	H	H	2	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ia-40	COOH	H	H	H	H	H	H	2	Me	3-thienyl
Ia-41	COOH	Me	H	H	H	H	H	2	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ia-42	COOH	H	H	H	H	Me	H	2	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ia-43	COOH	H	H	OMe	H	H	H	2	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ia-44	COOH	H	H	Cl	H	H	H	2	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ia-45	COOH	H	H	F	H	H	H	2	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ia-46	COOH	H	H	H	F	H	H	2	Me	4-F-C ₆ H ₅
Ia-47	COOH	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ CH=CH ₂	4-F-C ₆ H ₄
Ia-48	COOH	H	H	H	H	H	H	2	iPr	4-F-C ₆ H ₄
Ia-49	COOH	H	H	H	H	H	H	2	C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ia-50	COOH	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ C ₆ H ₅	C ₆ H ₅
Ia-51	COOH	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ia-52	CONH Ms	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄

(表 3)



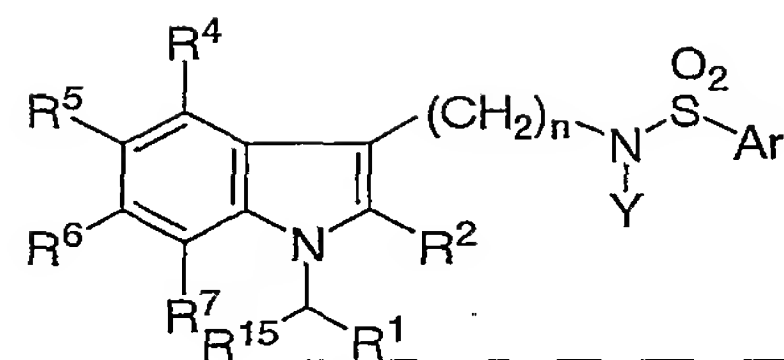
No	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ¹⁵	n	Y	Ar
Ia-53	COOH	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ C ₆ H ₅	4-OMe-C ₆ H ₄
Ia-54	COOH	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ C ₆ H ₅	3-thienyl
Ia-55	COOH	Me	H	H	H	H	H	2	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ia-56	COOH	H	H	H	H	Me	H	2	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ia-57	COOH	H	H	OMe	H	H	H	2	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ia-58	COOH	H	H	Cl	H	H	H	2	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ia-59	COOH	H	H	F	H	H	H	2	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ia-60	COOH	H	H	H	F	H	H	2	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₅
Ia-61	COOH	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ C ₆ H ₄ -2-Me	4-F-C ₆ H ₄
Ia-62	COOH	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ C ₆ H ₄ -4-OMe	4-F-C ₆ H ₄
Ia-63	COOH	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ C ₆ H ₄ -4-NO ₂	4-F-C ₆ H ₄
Ia-64	COOH	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ -1-naphthyl	4-F-C ₆ H ₄
Ia-65	COOH	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ -2-thienyl	4-F-C ₆ H ₄
Ia-66	COOH	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ia-67	COOH	H	H	H	H	H	H	3	H	C ₆ H ₅
Ia-68	COOH	H	H	H	H	H	H	3	H	2-F-C ₆ H ₄
Ia-69	COOH	H	H	H	H	H	H	3	H	4-F-C ₆ H ₄
Ia-70	COOH	H	H	H	H	H	H	3	H	2-Me-C ₆ H ₄
Ia-71	COOH	H	H	H	H	H	H	3	H	4-Me-C ₆ H ₄
Ia-72	COOH	H	H	H	H	H	H	3	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ia-73	COOH	H	H	H	H	H	H	3	H	2-thienyl
Ia-74	COOH	H	H	H	H	H	H	3	H	C ₆ H ₄ -4-OC ₆ H ₅
Ia-75	COOH	Me	H	H	H	H	H	3	H	C ₆ H ₅
Ia-76	COOH	Me	H	H	H	H	H	3	H	4-F-C ₆ H ₄
Ia-77	COOH	H	H	Cl	H	H	H	3	H	C ₆ H ₅
Ia-78	COOH	H	H	Cl	H	H	H	3	H	2-F-C ₆ H ₄

(表 4)



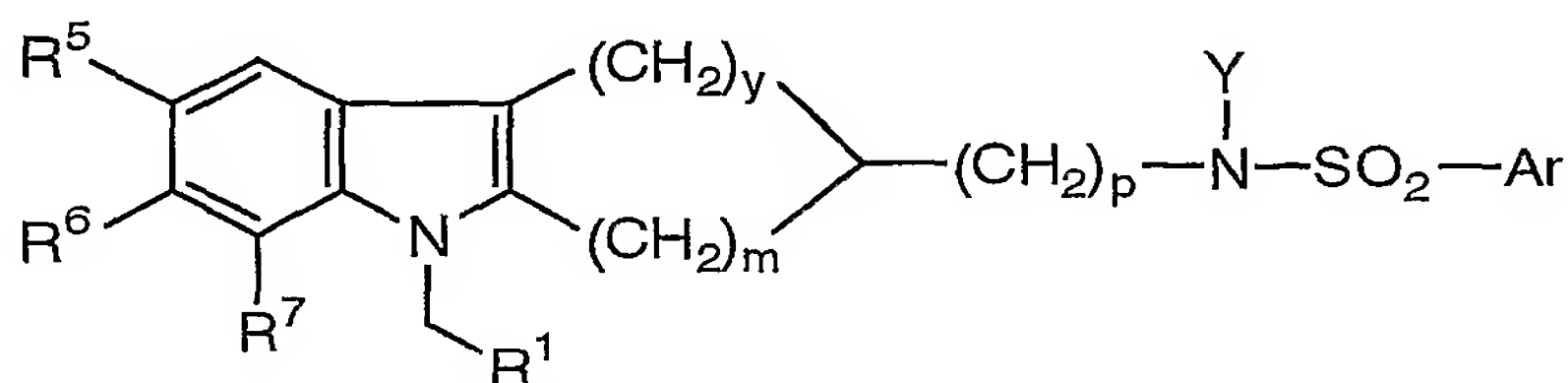
No	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ¹⁵	n	Y	Ar
Ia-79	COOH	H	H	Cl	H	H	H	3	H	4-F-C ₆ H ₄
Ia-80	COOH	H	H	H	H	H	H	3	Me	C ₆ H ₅
Ia-81	COOH	H	H	H	H	H	H	3	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ia-82	COOH	H	H	H	H	H	H	3	Me	3-thienyl
Ia-83	COOH	Me	H	H	H	H	H	3	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ia-84	COOH	H	H	H	H	H	H	3	CH ₂ C ₆ H ₅	C ₆ H ₅
Ia-85	COOH	H	H	H	H	H	H	3	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ia-86	COOH	H	H	H	H	H	H	3	CH ₂ C ₆ H ₅	3-thienyl
Ia-87	COOH	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	4-Me-C ₆ H ₄
Ia-88	COOH	H	H	H	H	H	H	2	H	4-Cl-C ₆ H ₄
Ia-89	COOH	H	H	F	H	H	H	2	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ia-90	COOH	H	H	F	H	H	H	2	H	2-thienyl
Ia-91	COOH	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	2-thienyl
Ia-92	COOH	H	H	Cl	H	H	H	2	CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ia-93	COOH	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ CH=CHC ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ia-94	COOH	H	H	H	H	H	H	2	CH ₂ CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ia-95	COOH	H	H	F	H	H	H	2	H	4-Me-C ₆ H ₄
Ia-96	COOH	H	H	F	H	H	H	2	H	2-naphthyl
Ia-97	COOH	H	H	F	H	H	H	2	H	4-NO ₂ -C ₆ H ₄
Ia-98	COOH	H	H	F	H	H	H	2	H	1-naphthyl
Ia-99	COOH	H	H	F	H	H	H	2	H	4-CN-C ₆ H ₄
Ia-100	COOH	H	H	OH	H	H	H	2	H	2-F-C ₆ H ₄
Ia-101	COOH	H	F	H	H	H	H	2	H	4-F-C ₆ H ₄
Ia-102	COOH	H	F	H	H	H	H	2	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ia-103	COOH	H	F	H	H	H	H	2	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ia-104	COOH	H	H	Cl	H	H	Me	2	H	4-F-C ₆ H ₄

(表 5)



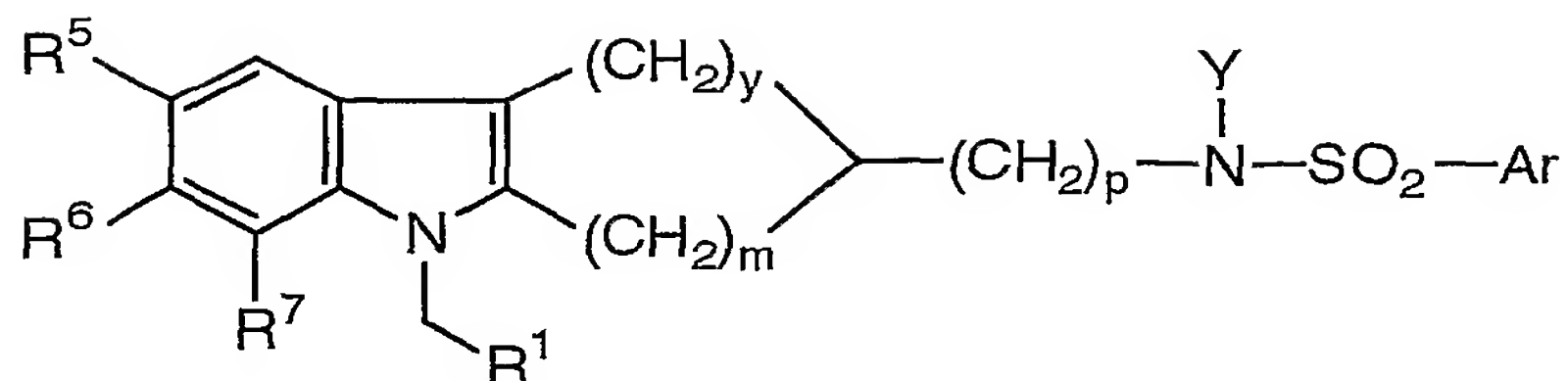
No	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ¹⁵	n	Y	Ar
Ia-105	COOH	H	H	Cl	H	H	Me	2	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ia-106	COOH	H	H	Cl	H	H	Me	2	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄

(表 6)



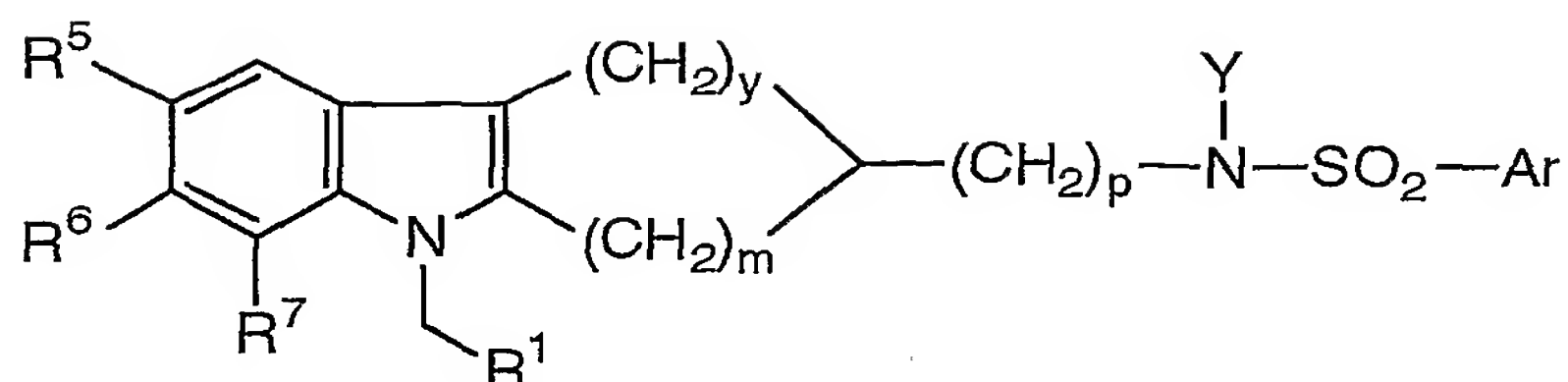
No	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁷	y	m	p	Y	Ar
Ib-1	COOH	H	H	H	1	1	0	H	C ₆ H ₅
Ib-2	COOH	H	H	H	1	1	0	H	4-F-C ₆ H ₄
Ib-3	COOH	H	H	H	1	1	0	H	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-4	COOH	H	H	H	1	1	0	H	2-thienyl
Ib-5	COOH	H	H	H	1	1	0	Me	C ₆ H ₅
Ib-6	COOH	H	H	H	1	1	0	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ib-7	COOH	H	H	H	1	1	0	Me	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-8	COOH	H	H	H	1	1	0	Me	2-thienyl
Ib-9	COOH	H	H	H	1	1	0	Et	C ₆ H ₅
Ib-10	COOH	H	H	H	1	1	0	CH ₂ C ₆ H ₅	C ₆ H ₅
Ib-11	COOH	H	H	H	1	1	0	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ib-12	COOH	H	H	H	1	1	0	CH ₂ C ₆ H ₅	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-13	COOH	H	H	H	1	1	0	CH ₂ C ₆ H ₅	2-thienyl
Ib-14	COOH	H	H	H	1	2	0	H	C ₆ H ₅
Ib-15	COOH	H	H	H	1	2	0	H	2-F-C ₆ H ₄
Ib-16	COOH	H	H	H	1	2	0	H	4-F-C ₆ H ₄
Ib-17	COOH	H	H	H	1	2	0	H	4-Cl-C ₆ H ₄
Ib-18	COOH	H	H	H	1	2	0	H	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-19	COOH	H	H	H	1	2	0	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ib-20	COOH	H	H	H	1	2	0	H	2-thienyl

(表 7)



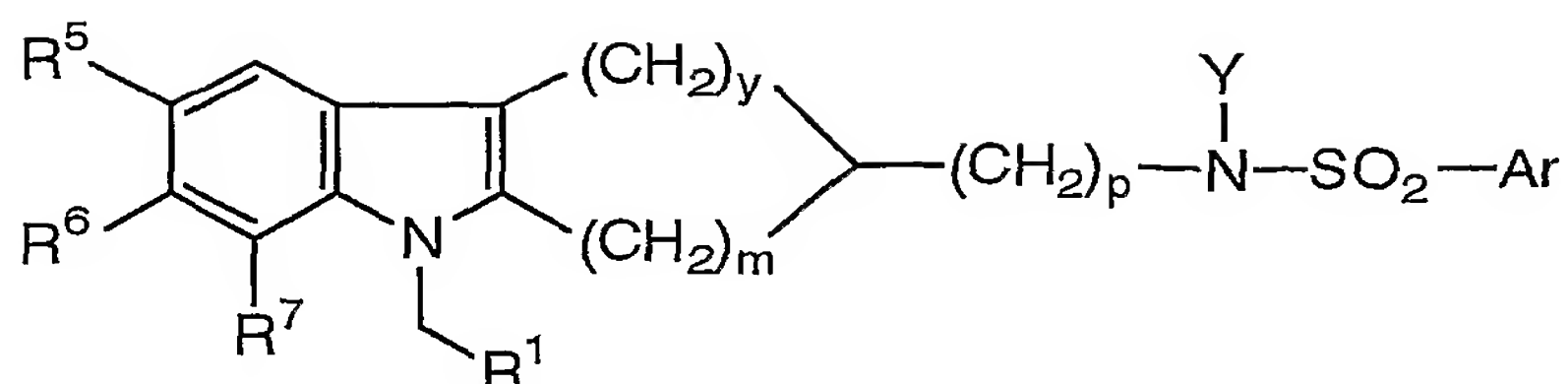
No	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁷	y	m	p	Y	Ar
Ib-21	COOH	H	H	H	1	2	0	H	3-thienyl
Ib-22	COOH	H	H	H	1	2	0	H	5-benzyl-2-thienyl
Ib-23	COOH	H	H	H	1	2	0	Me	C ₆ H ₅
Ib-24	COOH	H	H	H	1	2	0	Me	2-F-C ₆ H ₄
Ib-25	COOH	H	H	H	1	2	0	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ib-26	COOH	H	H	H	1	2	0	Me	4-Cl-C ₆ H ₄
Ib-27	COOH	H	H	H	1	2	0	Me	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-28	COOH	H	H	H	1	2	0	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ib-29	COOH	H	H	H	1	2	0	Me	2-thienyl
Ib-30	COOH	H	H	H	1	2	0	Me	3-thienyl
Ib-31	COOH	H	H	H	1	2	0	Me	5-benzyl-2-thienyl
Ib-32	COOH	H	H	H	1	2	0	Et	4-F-C ₆ H ₄
Ib-33	COOH	H	H	H	1	2	0	Et	4-OMe-C ₆ H ₄
Ib-34	COOH	H	H	H	1	2	0	CH ₂ C ₆ H ₅	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-35	COOH	Cl	H	H	1	2	0	H	C ₆ H ₅
Ib-36	COOH	Cl	H	H	1	2	0	H	4-F-C ₆ H ₄
Ib-37	COOH	Cl	H	H	1	2	0	H	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-38	COOH	Cl	H	H	1	2	0	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ib-39	COOH	Cl	H	H	1	2	0	H	3-thienyl
Ib-40	COOH	Cl	H	H	1	2	0	Me	C ₆ H ₅
Ib-41	COOH	Cl	H	H	1	2	0	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ib-42	COOH	Cl	H	H	1	2	0	Me	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-43	COOH	Cl	H	H	1	2	0	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ib-44	COOH	Cl	H	H	1	2	0	Me	3-thienyl
Ib-45	COOH	Cl	H	H	1	2	0	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ib-46	COOH	F	H	H	1	2	0	H	4-F-C ₆ H ₄
Ib-47	COOH	F	H	H	1	2	0	Me	4-F-C ₆ H ₄

(表 8)



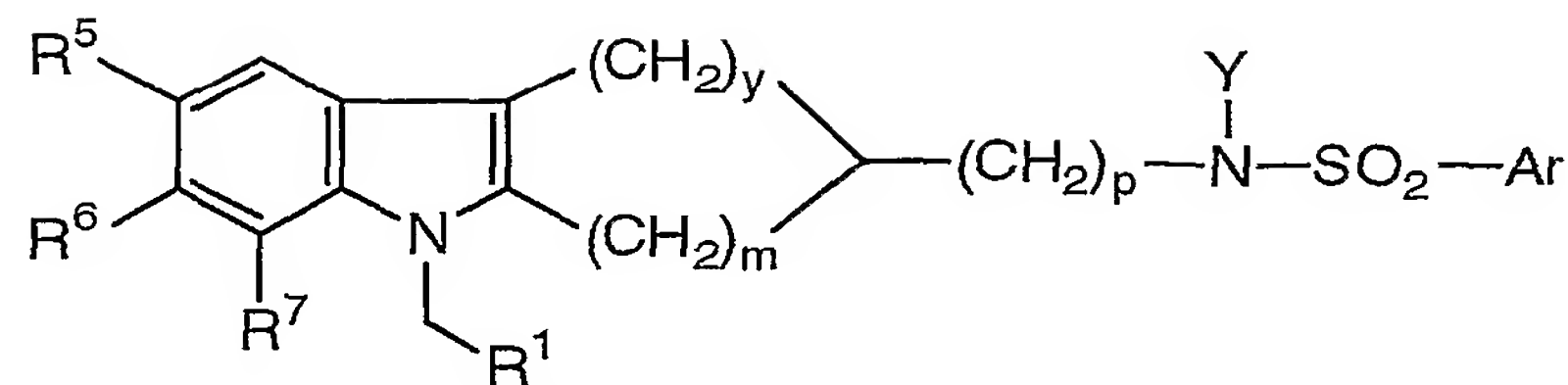
No	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁷	y	m	p	Y	Ar
Ib-48	COOH	F	H	H	1	2	0	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ib-49	COOH	H	H	H	2	1	0	H	C ₆ H ₅
Ib-50	COOH	H	H	H	2	1	0	H	2-F-C ₆ H ₄
Ib-51	COOH	H	H	H	2	1	0	H	4-F-C ₆ H ₄
Ib-52	COOH	H	H	H	2	1	0	H	4-Cl-C ₆ H ₄
Ib-53	COOH	H	H	H	2	1	0	H	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-54	COOH	H	H	H	2	1	0	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ib-55	COOH	H	H	H	2	1	0	H	2-thienyl
Ib-56	COOH	H	H	H	2	1	0	H	3-thienyl
Ib-57	COOH	H	H	H	2	1	0	Me	C ₆ H ₅
Ib-58	COOH	H	H	H	2	1	0	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ib-59	COOH	H	H	H	2	1	0	Me	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-60	COOH	H	H	H	2	1	0	Me	2-thienyl
Ib-61	COOH	H	H	H	2	1	0	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ib-62	COOH	H	H	H	2	2	0	H	C ₆ H ₅
Ib-63	COOH	H	H	H	2	2	0	H	4-F-C ₆ H ₄
Ib-64	COOH	H	H	H	2	2	0	H	4-Cl-C ₆ H ₄
Ib-65	COOH	H	H	H	2	2	0	H	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-66	COOH	H	H	H	2	2	0	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ib-67	COOH	H	H	H	2	2	0	H	2-thienyl
Ib-68	COOH	H	H	H	2	2	0	Me	C ₆ H ₅
Ib-69	COOH	H	H	H	2	2	0	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ib-70	COOH	H	H	H	2	2	0	Me	4-Cl-C ₆ H ₄
Ib-71	COOH	H	H	H	2	2	0	Me	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-72	COOH	H	H	H	2	2	0	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ib-73	COOH	H	H	H	2	2	0	Me	2-thienyl
Ib-74	COOH	H	H	H	2	2	0	CH ₂ C ₆ H ₅	C ₆ H ₅

(表 9)



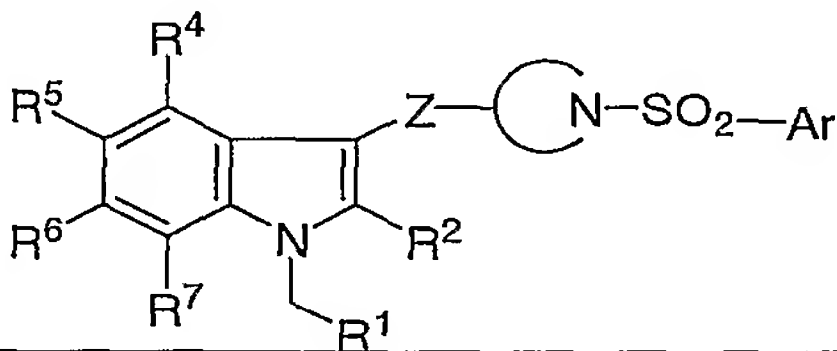
No	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁷	y	m	p	Y	Ar
Ib-75	COOH	H	H	H	2	2	0	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ib-76	COOH	H	H	H	0	2	1	H	C ₆ H ₅
Ib-77	COOH	H	H	H	0	2	1	H	4-F-C ₆ H ₄
Ib-78	COOH	H	H	H	0	2	1	H	4-Cl-C ₆ H ₄
Ib-79	COOH	H	H	H	0	2	1	H	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-80	COOH	H	H	H	0	2	1	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ib-81	COOH	H	H	H	0	2	1	H	2-thienyl
Ib-82	COOH	H	H	H	0	2	1	Me	C ₆ H ₅
Ib-83	COOH	H	H	H	0	2	1	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ib-84	COOH	H	H	H	0	2	1	Me	4-Cl-C ₆ H ₄
Ib-85	COOH	H	H	H	0	2	1	Me	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-86	COOH	H	H	H	0	2	1	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ib-87	COOH	H	H	H	0	2	1	Me	2-thienyl
Ib-88	COOH	H	H	H	0	2	1	CH ₂ C ₆ H ₅	C ₆ H ₅
Ib-89	COOH	H	H	H	0	2	1	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ib-90	COOH	H	H	H	1	1	1	H	C ₆ H ₅
Ib-91	COOH	H	H	H	1	1	1	H	4-F-C ₆ H ₄
Ib-92	COOH	H	H	H	1	1	1	H	4-Cl-C ₆ H ₄
Ib-93	COOH	H	H	H	1	1	1	H	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-94	COOH	H	H	H	1	1	1	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ib-95	COOH	H	H	H	1	1	1	H	2-thienyl
Ib-96	COOH	H	H	H	1	1	1	Me	C ₆ H ₅
Ib-97	COOH	H	H	H	1	1	1	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ib-98	COOH	H	H	H	1	1	1	Me	4-Cl-C ₆ H ₄
Ib-99	COOH	H	H	H	1	1	1	Me	4-Me-C ₆ H ₄
Ib-100	COOH	H	H	H	1	1	1	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ib-101	COOH	H	H	H	1	1	1	Me	2-thienyl

(表 1 0)



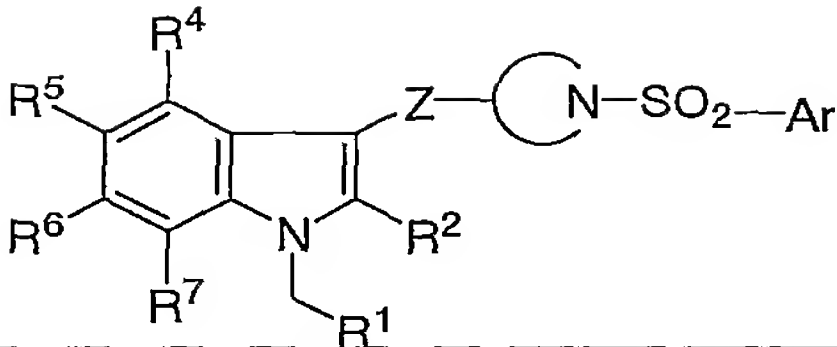
No	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ⁷	y	m	p	Y	Ar
Ib-102	COOH	H	H	H	1	1	1	CH ₂ C ₆ H ₅	C ₆ H ₅
Ib-103	COOH	H	H	H	1	1	1	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄

(表 1 1)



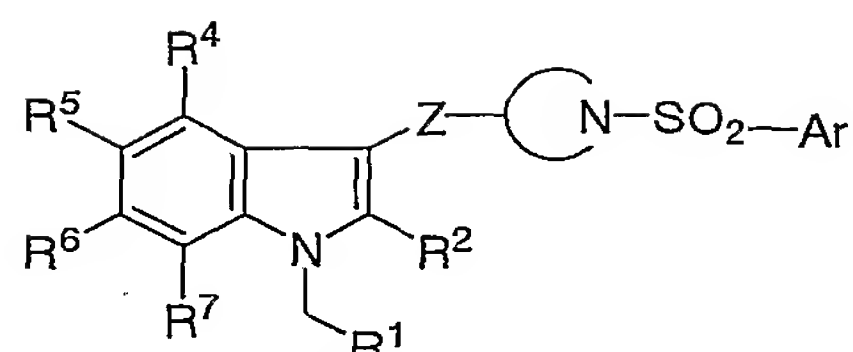
No	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷		Ar
Ic-1	COOH	H	H	H	H	H		C ₆ H ₅
Ic-2	COOH	H	H	H	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-3	COOH	H	H	H	H	H		4-Me-C ₆ H ₄
Ic-4	COOH	H	H	H	H	H		2-thienyl
Ic-5	COOH	H	H	H	H	H		C ₆ H ₅
Ic-6	COOH	H	H	H	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-7	COOH	H	H	H	H	H		4-Me-C ₆ H ₄
Ic-8	COOH	H	H	H	H	H		2-thienyl
Ic-9	COOH	Me	H	H	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-10	COOH	H	H	Cl	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-11	COOH	H	H	F	H	H		4-F-C ₆ H ₄

(表 1 2)



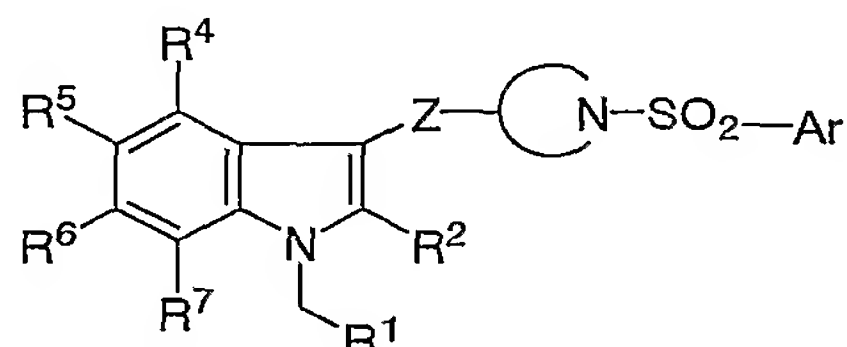
No	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷		Ar
Ic-12	COOH	H	H	H	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-13	COOH	H	H	H	H	H		C ₆ H ₅
Ic-14	COOH	H	H	H	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-15	COOH	H	H	H	H	H		4-Me-C ₆ H ₄
Ic-16	COOH	H	H	H	H	H		2-thienyl
Ic-17	COOH	Me	H	H	H	H		C ₆ H ₅
Ic-18	COOH	Me	H	H	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-19	COOH	H	H	Cl	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-20	COOH	H	H	F	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-21	COOH	H	H	H	H	H		C ₆ H ₅
Ic-22	COOH	H	H	H	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-23	COOH	H	H	H	H	H		C ₆ H ₅
Ic-24	COOH	H	H	H	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-25	COOH	H	H	H	H	H		C ₆ H ₅
Ic-26	COOH	H	H	H	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-27	COOH	H	H	H	H	H		2-thienyl

(表 1 3)



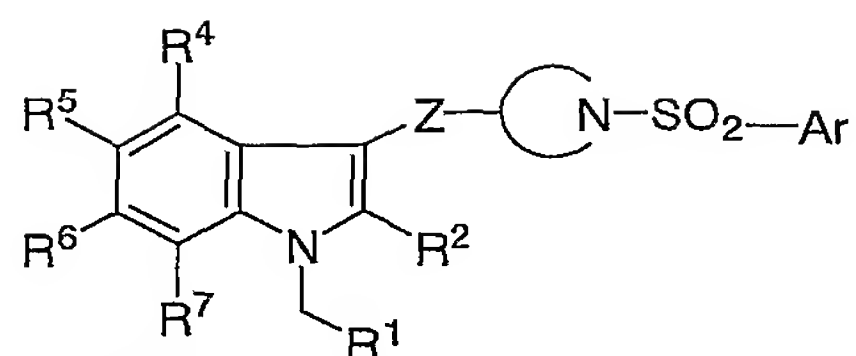
No	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Z-(N-)	Ar
Ic-28	COOH	H	H	H	H	H		C ₆ H ₅
Ic-29	COOH	H	H	H	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-30	COOH	H	H	H	H	H		4-OMe-C ₆ H ₄

(表 1 4)



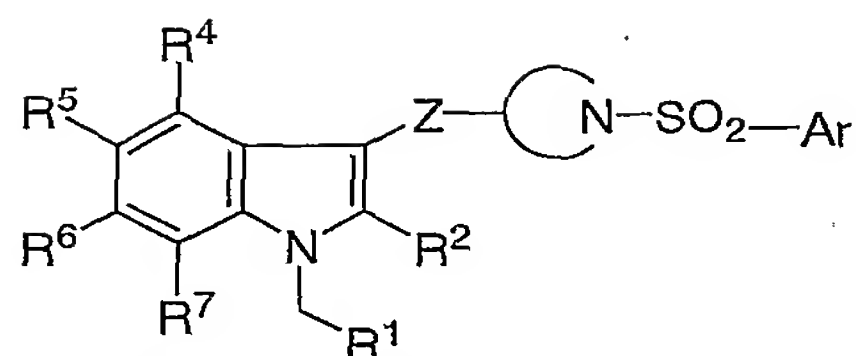
No	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Z-(N-)	Ar
Ic-31	COOH	H	H	Cl	H	H		2-thienyl
Ic-32	COOH	H	H	Me	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-33	COOH	H	H	Me	H	H		4-Me-C ₆ H ₄
Ic-34	COOH	H	H	Cl	H	H		C ₆ H ₅
Ic-35	COOH	H	H	Cl	H	H		CH ₂ C ₆ H ₅
Ic-36	COOH	H	H	Cl	H	H		4-Cl-C ₆ H ₄
Ic-37	COOH	H	H	Cl	H	H		4-Me-C ₆ H ₄
Ic-38	COOH	H	H	F	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-39	COOH	Me	H	F	H	H		2-thienyl
Ic-40	COOH	H	H	OMe	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-41	COOH	H	H	OMe	H	H		2-thienyl

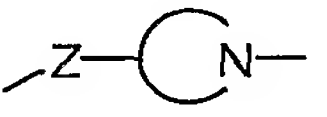
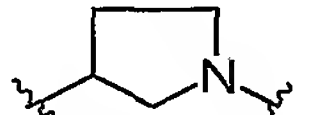


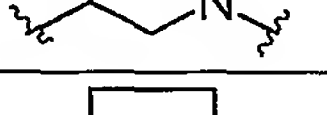
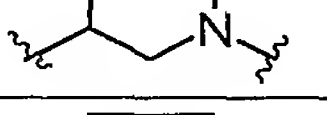
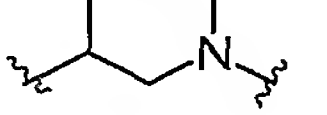
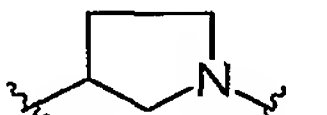



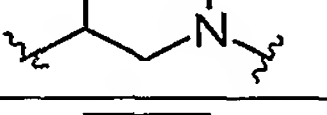
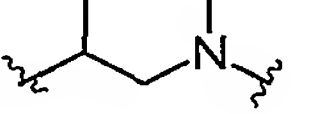
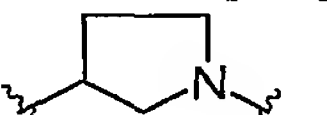
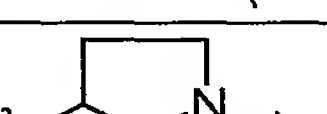
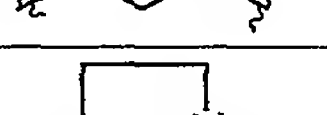
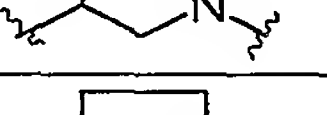
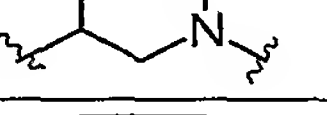
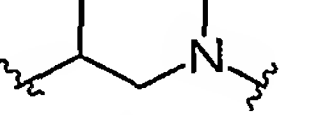

(表 1 5)



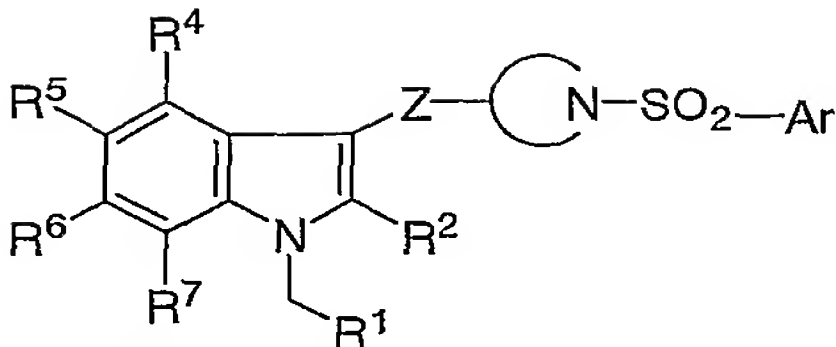
No	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷		Ar
Ic-42	COOH	H	H	OH	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-43	COOH	H	H	F	H	H		nBu
Ic-44	COOH	H	H	F	H	H		CH ₂ CH=CHC ₆ H ₅
Ic-45	COOH	H	H	F	H	H		4-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄
Ic-46	COOH	H	H	F	H	H		Me
Ic-47	COOH	H	H	C ₆ H ₅	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-48	COOH	H	H	C ₆ H ₅	H	H		nBu
Ic-49	COOH	H	H	C ₆ H ₅	H	H		2-thienyl
Ic-50	COOH	H	H	F	H	H		CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅
Ic-51	COOH	H	H	H	Cl	H		4-F-C ₆ H ₄
c-52	COOH	H	H	H	Cl	H		2-thienyl
Ic-53	COOH	H	H	Cl	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-54	COOH	H	H	Cl	H	H		3-F-C ₆ H ₄
Ic-55	COOH	Me	H	Cl	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-56	COOH	Me	H	Cl	H	H		2-thienyl
Ic-57	COOH	H	H	Cl	H	H		nBu
Ic-58	COOH	H	H	Cl	H	H		4-CF ₃ -C ₆ H ₄
Ic-59	COOH	H	H	Cl	H	H		nBu
Ic-60	COOH	H	H	Cl	H	H		Octyl

(表 1 6)



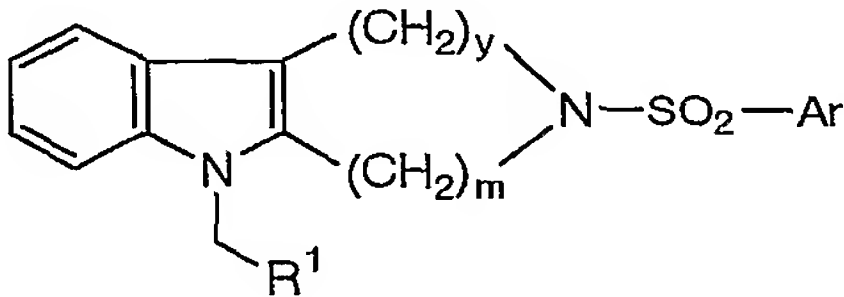
No	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷		Ar
Ic-61	COOH	H	H	Cl	H	H		1-naphthyl
Ic-62	COOH	H	H	Cl	H	H		4-NO ₂ -C ₆ H ₄
Ic-63	COOH	H	H	Cl	H	H		4-CN-C ₆ H ₄
Ic-64	COOH	H	Cl	H	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-65	COOH	H	Cl	H	H	H		2-thienyl
Ic-66	COOH	H	Cl	H	H	H		nBu
Ic-67	COOH	H	H	Cl	H	H		5-benzyl-thiophen-2-yl
Ic-68	COOH	H	H	Cl	H	H		Quinolin-8-yl
Ic-69	COOH	H	H	Cl	H	H		3-thienyl
Ic-70	COOH	H	H	Cl	H	H		Benzo[<i>b</i>]thiophen-3-yl
Ic-71	COOH	H	H	Cl	H	H		2,4-diF-C ₆ H ₃
Ic-72	COOH	H	H	Cl	H	H		Me
Ic-73	COOH	H	H	Cl	H	H		4-OMe-C ₆ H ₄
Ic-74	COOH	H	H	Cl	H	H		CH ₂ CH=CHC ₆ H ₅
Ic-75	COOH	H	H	Cl	H	H		Pyridin-3-yl
Ic-76	COOH	Me	H	H	H	H		2-thienyl
Ic-77	COOH	Me	H	H	H	H		nBu
Ic-78	COOH	H	H	Cl	H	H		5-Cl-thiophen-2-yl
Ic-79	COOH	H	H	Cl	H	H		4-OH-C ₆ H ₄

(表 1 7)



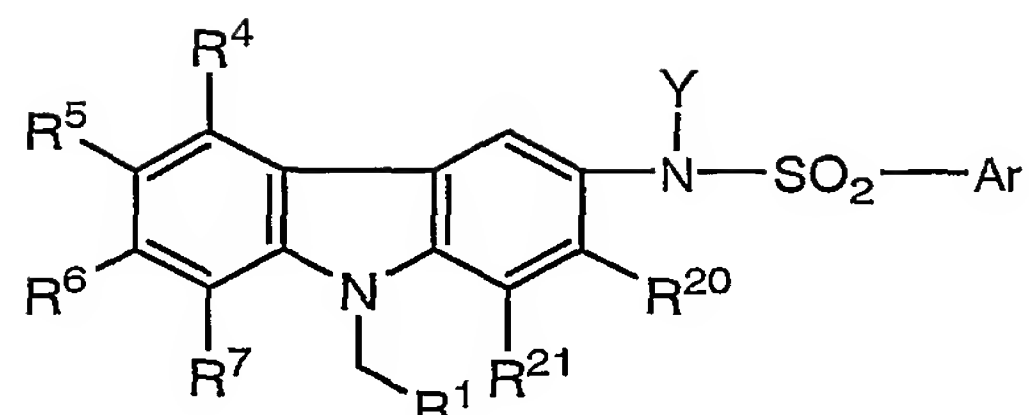
No	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷		Ar
Ic-80	COOH	H	H	H	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-81	COOH	H	H	H	H	H		4-OMe-C ₆ H ₄
Ic-82	COOH	H	H	F	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-83	COOH	H	H	F	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-84	COOH	H	H	F	H	H		4-F-C ₆ H ₄
Ic-85	COOH	H	H	F	H	H		4-OMe-C ₆ H ₄

(表 1 8)



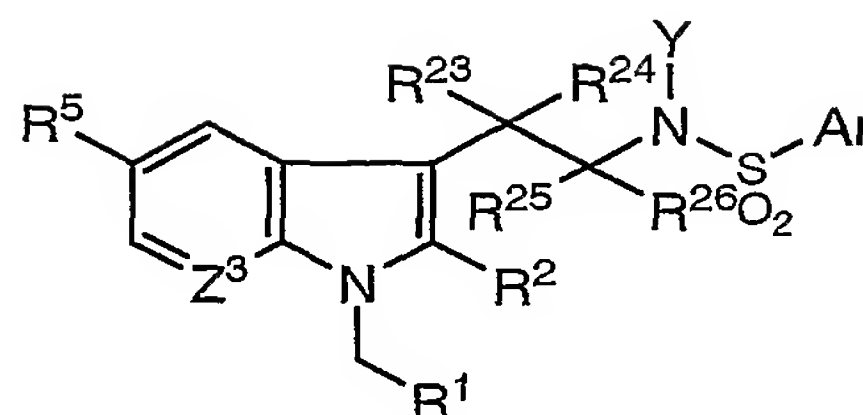
No	y	m	R ¹	Ar
Id-1	1	2	COOH	C ₆ H ₅
Id-2	1	2	COOH	4-F-C ₆ H ₄
Id-3	1	2	COOH	2-thienyl
Id-4	2	1	COOH	C ₆ H ₅
Id-5	2	1	COOH	4-F-C ₆ H ₄
Id-6	2	1	COOH	2-thienyl

(表 19)



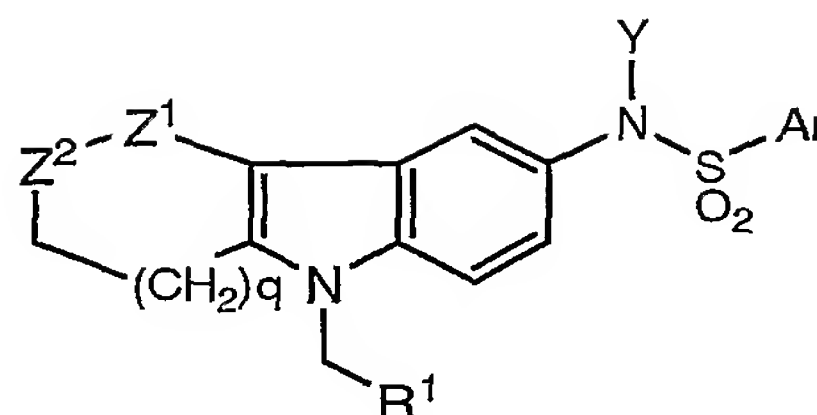
No	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ²⁰	R ²¹	Y	Ar
Ie-1	COOH	H	H	H	H	H	H	H	C ₆ H ₅
Ie-2	COOH	H	H	H	H	H	H	H	4-F-C ₆ H ₄
Ie-3	COOH	H	H	H	H	H	H	H	2-thienyl
Ie-4	COOH	H	H	H	H	H	H	Me	C ₆ H ₅
Ie-5	COOH	H	H	H	H	H	H	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ie-6	COOH	H	H	H	H	H	H	Me	2-thienyl
Ie-7	COOH	H	H	H	H	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅	C ₆ H ₅
Ie-8	COOH	H	H	H	H	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ie-9	COOH	H	H	H	H	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅	2-thienyl
Ie-10	COOH	H	H	F	H	H	H	H	4-F-C ₆ H ₄
Ie-11	COOH	H	H	Me	H	H	H	H	4-F-C ₆ H ₄
Ie-12	COOH	H	H	F	H	H	H	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ie-13	COOH	H	H	F	H	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ie-14	COOH	H	H	Me	H	H	H	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ie-15	COOH	H	H	H	H	Me	H	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ie-16	COOH	H	F	H	H	H	H	H	4-F-C ₆ H ₄
Ie-17	COOH	H	F	H	H	H	H	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ie-18	COOH	H	F	H	H	H	H	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ie-19	COOH	F	H	H	H	H	H	H	4-F-C ₆ H ₄
Ie-20	COOH	F	H	H	H	H	H	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ie-21	COOH	F	H	H	H	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ie-22	COOH	H	H	H	H	H	F	H	4-F-C ₆ H ₄
Ie-23	COOH	H	H	H	H	H	F	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ie-24	COOH	H	H	H	H	H	F	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ie-25	COOH	H	H	H	F	H	H	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ie-26	COOH	H	H	H	F	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ie-27	COOH	H	Br	H	H	H	H	H	4-F-C ₆ H ₄

(表 20)



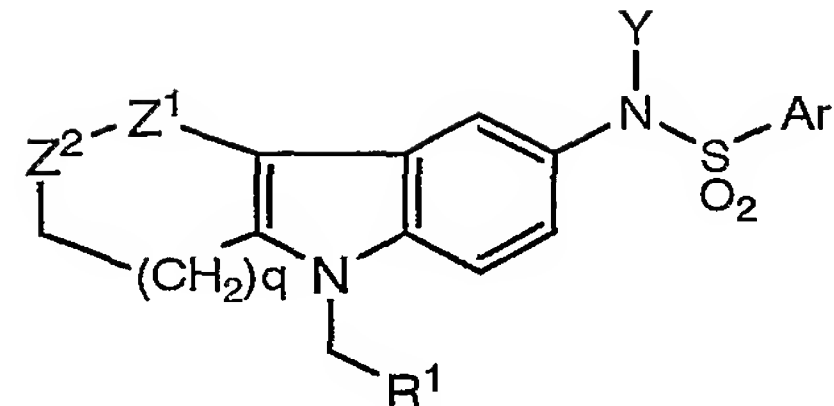
No	R ¹	R ²	R ⁵	R ²³	R ²⁴	R ²⁵	R ²⁶	Z ³	Y	Ar
If-1	COOH	Me	H	Me	Me	H	H	=CH-	H	4-F-C ₆ H ₄
If-2	COOH	Me	H	Me	Me	H	H	=CH-	Me	4-F-C ₆ H ₄
If-3	COOH	Me	H	Me	Me	H	H	=CH-	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
If-4	COOH	Me	H	Me	H	H	H	=CH-	H	4-F-C ₆ H ₄
If-5	COOH	Me	H	Me	H	H	H	=CH-	Me	4-F-C ₆ H ₄
If-6	COOH	Me	H	Me	H	H	H	=CH-	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
If-7	COOH	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	=CH-	Me	4-F-C ₆ H ₄
If-8	COOH	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	=CH-	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
If-9	COOH	H	H	C ₆ H ₅	H	H	H	=CH-	H	4-F-C ₆ H ₄
If-10	COOH	Me	H	C ₆ H ₅	H	H	H	=CH-	Me	4-F-C ₆ H ₄
If-11	COOH	H	H	-(CH ₂) ₃ -		H	H	=CH-	H	4-F-C ₆ H ₄
If-12	COOH	H	H	-(CH ₂) ₃ -		H	H	=CH-	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
If-13	COOH	H	H	Me	Me	H	H	=CH-	H	4-F-C ₆ H ₄
If-14	COOH	H	H	Me	Me	H	H	=CH-	Me	4-F-C ₆ H ₄
If-15	COOH	H	H	Me	Me	H	H	=CH-	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
If-16	COOH	H	H	H	H	CH ₂ OMe	H	=CH-	H	4-F-C ₆ H ₄
If-17	COOH	H	Cl	Me	Me	H	H	=CH-	H	4-F-C ₆ H ₄
If-18	COOH	H	Cl	Me	Me	H	H	=CH-	Me	4-F-C ₆ H ₄
If-19	COOH	H	Cl	Me	Me	H	H	=CH-	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
If-20	COOH	H	H	H	H	H	H	=N-	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄

(表 2 1)



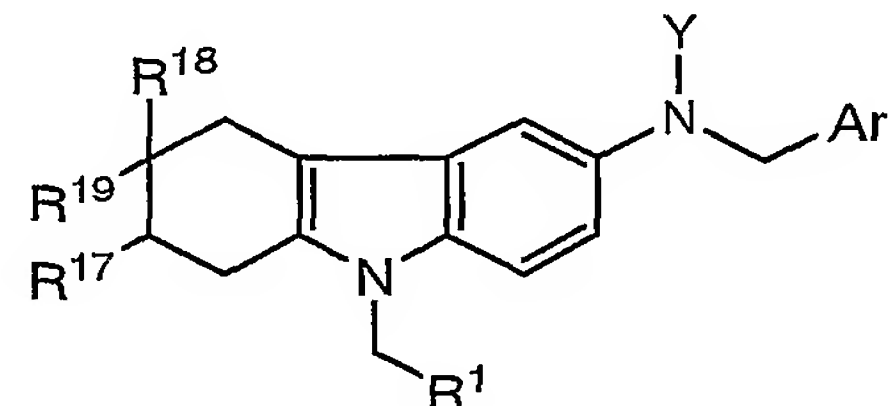
No	R ¹	Z ¹	Z ²	q	Y	Ar
Ig-1	COOH	-CH ₂ -	-CH ₂ -	0	H	4-F-C ₆ H ₄
Ig-2	COOH	-CH ₂ -	-S-	1	H	4-F-C ₆ H ₄
Ig-3	COOH	-CH ₂ -	-S-	1	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ig-4	COOH	-C(=O)-	-CH ₂ -	1	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ig-5	COOH	-C(=O)-	-CH(Et)-	1	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ig-6	COOH	-CH ₂ -	-N(COOEt)-	1	H	4-F-C ₆ H ₄
Ig-7	COOH	-CH ₂ -	-N(COOEt)-	1	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ig-8	COOH	-CH ₂ -	-N(COOEt)-	1	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ig-9	COOH	-CH ₂ -	-N(COOEt)-	1	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ig-10	COOH	-CH ₂ -	-N(COMe)-	1	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ig-11	COOH	-CH ₂ -	-CH ₂ -	2	H	4-F-C ₆ H ₄
Ig-12	COOH	-CH ₂ -	-CH ₂ -	2	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ig-13	COOH	-CH ₂ -	-CH ₂ -	2	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ig-14	COOH	-CH ₂ -	-CH ₂ -	2	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ig-15	COOH	-CH ₂ -	-CH ₂ -	2	Et	4-F-C ₆ H ₄
Ig-16	COOH	-CH ₂ -	-CH ₂ -	2	Me	4-OH-C ₆ H ₄
Ig-17	COOH	-CH ₂ -	-NH-	2	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ig-18	COOH	-CH ₂ -	-CH ₂ -	3	H	4-F-C ₆ H ₄
Ig-19	COOH	-CH ₂ -	-CH ₂ -	3	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ig-20	COOH	-CH ₂ -	-CH ₂ -	3	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ig-21	COOH	-CH ₂ -	-CH ₂ -	0	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ig-22	COOH	-CH ₂ -	-S(=O)-	1	H	4-F-C ₆ H ₄
Ig-23	COOH	-CH ₂ -	-S(=O)-	1	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ig-24	COOH	-C(=O)-	-NH-	2	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ig-25	COOH	-C(=O)-	-NH-	2	Me	4-OMe-C ₆ H ₄

(表 2 2)



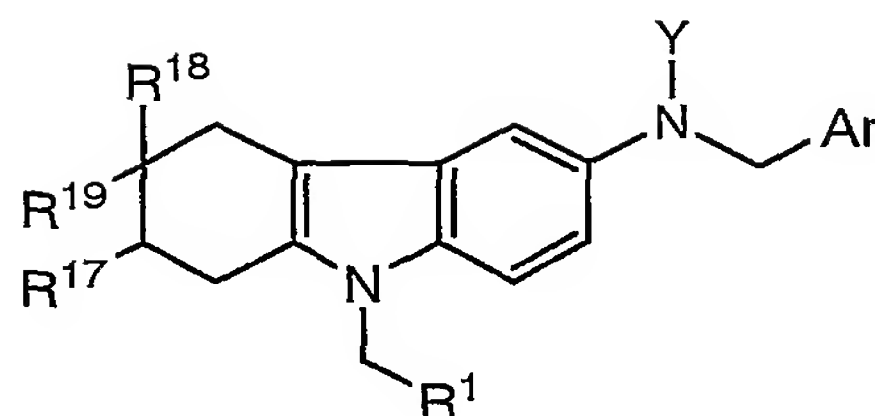
No	R ¹	Z ¹	Z ²	q	Y	Ar
Ig-26	COOH	C(=NOH)-	-CH ₂ -	1	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ig-27	COOH	C(=NOMe)-	-CH ₂ -	1	Me	4-F-C ₆ H ₄

(表 2 3)



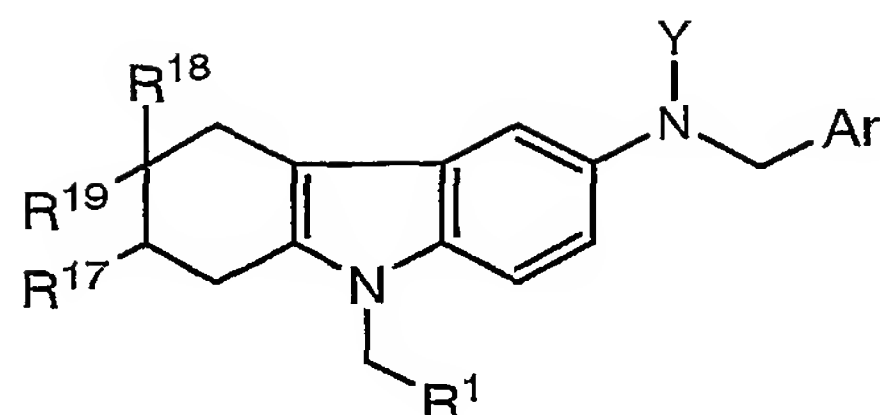
No	R ¹	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	Y	Ar
Ih-1	COOH	H	H	H	H	4-F-C ₆ H ₄
Ih-2	COOH	H	H	H	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ih-3	COOH	H	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ih-4	COOH	H	H	Me	H	4-F-C ₆ H ₄
Ih-5	COOH	H	H	Me	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ih-6	COOH	H	H	Me	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄
Ih-7	COOH	H	H	H	Me	2-thienyl
Ih-8	COOH	H	H	H	Me	nBu
Ih-9	COOH	H	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅	2-thienyl
Ih-10	COOH	H	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅	nBu
Ih-11	COOH	H	H	H	H	2-thienyl
Ih-12	COOH	H	H	H	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-13	COOH	H	H	H	H	4-OH-C ₆ H ₄
Ih-14	COOH	H	H	H	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-15	COOH	H	H	H	Me	4-OH-C ₆ H ₄
Ih-16	COOH	H	H	Et	H	4-F-C ₆ H ₄
Ih-17	COOH	H	H	Et	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-18	COOH	H	H	Et	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ih-19	COOH	H	H	Et	Me	4-OMe-C ₆ H ₄

(表 2 4)



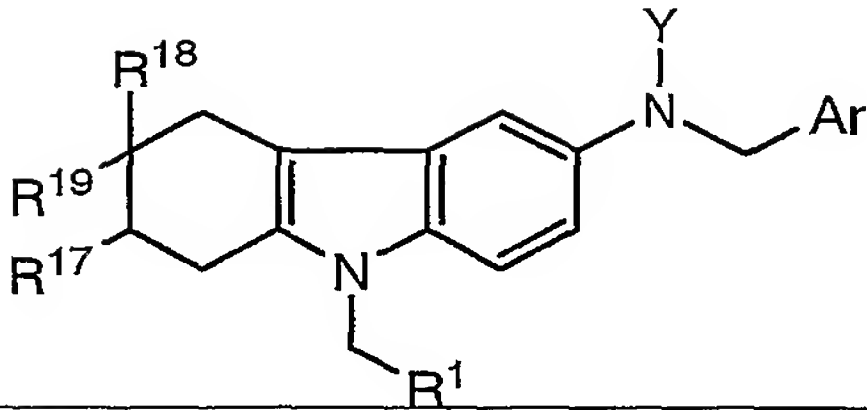
No	R ¹	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	Y	Ar
Ih-20	COOH	H	H	H	H	C ₆ H ₅
Ih-21	COOH	H	H	H	H	4-Me-C ₆ H ₄
Ih-22	COOH	H	H	H	Me	C ₆ H ₅
Ih-23	COOH	H	H	H	Me	4-Me-C ₆ H ₄
Ih-24	COOH	H	H	H	Me	CH ₂ C ₆ H ₅
Ih-25	COOH	H	H	H	Me	CH ₂ CH=CHC ₆ H ₅
Ih-26	COOH	H	Me	Me	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-27	COOH	H	Me	Me	H	4-F-C ₆ H ₄
Ih-28	COOH	H	Me	Me	H	2-thienyl
Ih-29	COOH	H	H	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅
Ih-30	COOH	H	H	H	H	CH ₂ CH=CHC ₆ H ₅
Ih-31	COOH	H	Me	Me	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ih-32	COOH	H	Me	Me	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-33	COOH	H	Me	Me	Me	2-thienyl
Ih-34	COOH	H	H	C ₆ H ₅	H	4-F-C ₆ H ₄
Ih-35	COOH	H	H	C ₆ H ₅	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-36	COOH	H	H	C ₆ H ₅	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ih-37	COOH	H	H	C ₆ H ₅	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-38	COOH	H	Et	Et	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-39	COOH	H	H	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄
Ih-40	COOH	H	H	H	H	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
Ih-41	COOH	H	H	H	Me	4-Cl-C ₆ H ₄
Ih-42	COOH	H	H	H	Me	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
Ih-43	COOH	H	H	H	Me	3-thienyl
Ih-44	COOH	H	H	H	Me	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄
Ih-45	COOH	H	Et	Et	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ih-46	COOH	H	Et	Et	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-47	COOH	H	-(CH ₂) ₅ -		H	4-F-C ₆ H ₄

(表 2 5)



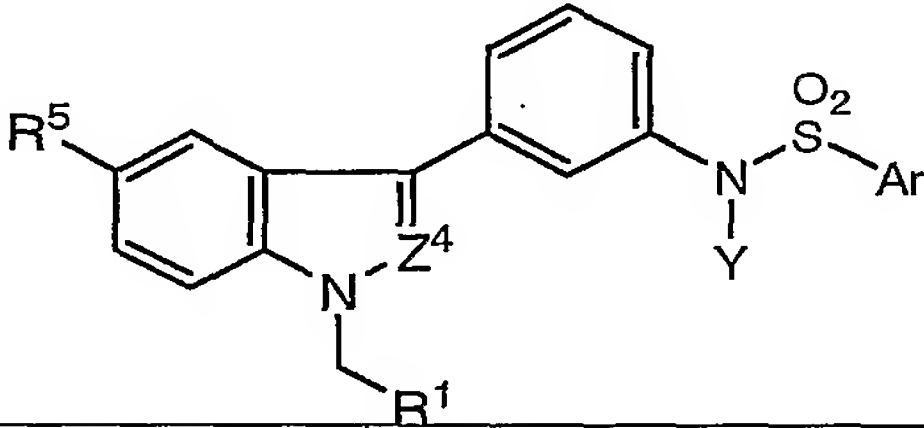
No	R ¹	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	Y	Ar
Ih-48	COOH	H	-(CH ₂) ₅ -		H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-49	COOH	H	H	H	H	3-thienyl
Ih-50	COOH	H	H	Pr	H	4-F-C ₆ H ₄
Ih-51	COOH	H	H	tBu	H	4-F-C ₆ H ₄
Ih-52	COOH	H	H	Pr	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-53	COOH	H	H	tBu	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-54	COOH	H	H	H	H	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄
Ih-55	COOH	H	-(CH ₂) ₅ -		Me	4-F-C ₆ H ₄
Ih-56	COOH	H	-(CH ₂) ₅ -		Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-57	COOH	H	H	Pr	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ih-58	COOH	H	H	tBu	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ih-59	COOH	H	H	Pr	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-60	COOH	H	H	tBu	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-61	COOH	H	H	pentyl	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ih-62	COOH	H	H	pentyl	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-63	COOH	H	H	H	Et	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-64	COOH	H	H	H	Pr	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-65	COOH	H	H	H	iBu	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-66	COOH	H	H	H	iPr	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-67	COOH	H	H	H	Et	4-F-C ₆ H ₄
Ih-68	COOH	H	H	H	Pr	4-F-C ₆ H ₄
Ih-69	COOH	H	H	H	allyl	4-F-C ₆ H ₄
Ih-70	COOH	H	H	H	propargyl	4-F-C ₆ H ₄
Ih-71	COOH	H	H	H	CH ₂ CF ₃	4-F-C ₆ H ₄
Ih-72	COOH	H	H	H	CH ₂ CH ₂ OH	4-F-C ₆ H ₄
Ih-73	COOH	H	H	H	cyclopropylmethyl	4-F-C ₆ H ₄
Ih-74	COOH	H	H	H	allyl	4-OMe-C ₆ H ₄

(表 2 6)



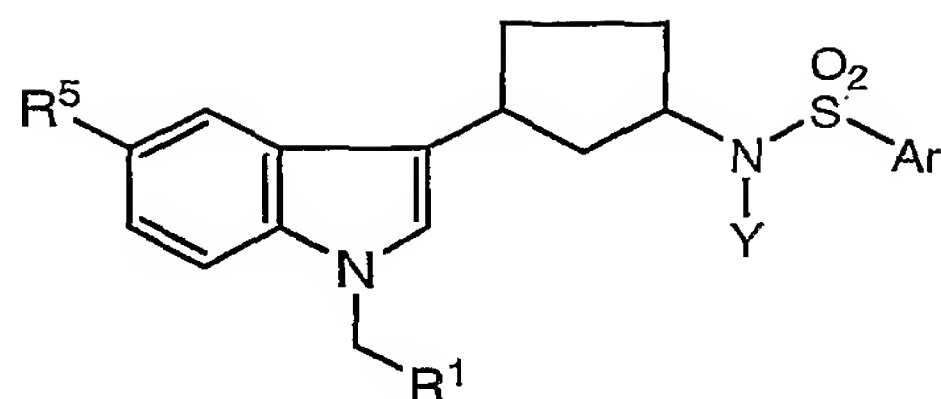
No	R ¹	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	Y	Ar
Ih-75	COOH	H	H	H	2-methylpropene	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-76	COOH	H	H	H	propargyl	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-77	COOH	H	H	H	cyclopropylmethyl	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-78	COOH	H	H	H	CH ₂ CH ₂ OH	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-79	COOH	H	H	H	cyclohexylmethyl	4-F-C ₆ H ₄
Ih-80	COOH	H	H	H	cyclohexylmethyl	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-81	COOH	H	H	H	CH ₂ OMe	4-F-C ₆ H ₄
Ih-82	COOH	H	H	H	CH ₂ OMe	4-OMe-C ₆ H ₄
Ih-83	COOH	Me	H	H	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ih-84	COOH	Me	H	H	Me	4-OMe-C ₆ H ₄

(表 2 7)



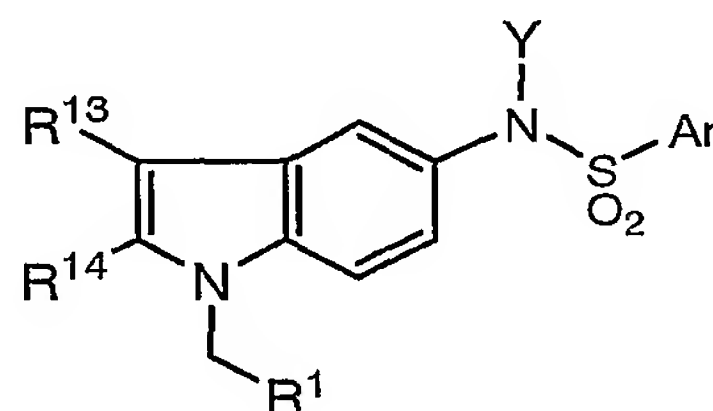
No	R ¹	R ⁵	Z ⁴	Y	Ar
Ii-1	COOH	Me	-N=	H	4-F-C ₆ H ₄
Ii-2	COOH	Me	-CH=	H	4-F-C ₆ H ₄
Ii-3	COOH	Me	-CH=	Me	4-F-C ₆ H ₄

(表 28)



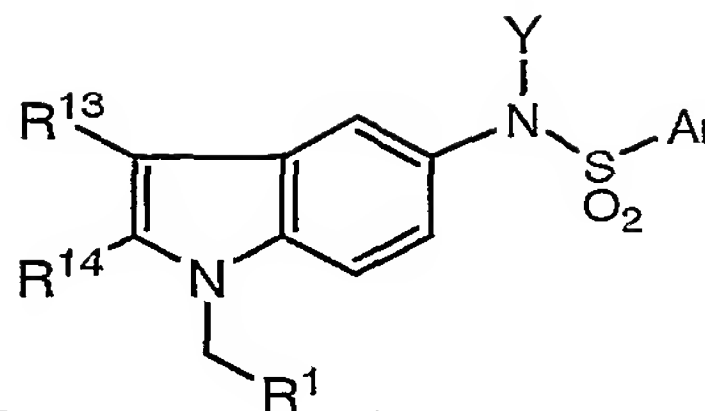
No	R ¹	R ⁵	Y	Ar
Ij-1	COOH	H	H	4-F-C ₆ H ₄
Ij-2	COOH	H	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ij-3	COOH	H	CH ₂ C ₆ H ₅	4-F-C ₆ H ₄

(表 29)



No	R ¹	R ¹³	Z ¹⁴	Y	Ar
Ik-1	COOH	Me	Me	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ik-2	COOH	H	Me	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ik-3	COOH	Et	Me	H	4-F-C ₆ H ₄
Ik-4	COOH	Pr	Me	H	4-F-C ₆ H ₄
Ik-5	COOH	Et	Me	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ik-6	COOH	iPr	Me	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ik-7	COOH	Me	Pr	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ik-8	COOH	Et	H	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ik-9	COOH	Pr	Me	H	4-F-C ₆ H ₄
Ik-10	COOH	Pr	Me	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ik-11	COOH	Et	Pr	H	4-F-C ₆ H ₄
Ik-12	COOH	Et	Pr	H	2-thienyl
Ik-13	COOH	Et	Pr	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ik-14	COOH	Et	Pr	Me	2-thienyl
Ik-15	COOH	Pr	Me	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ik-16	COOH	Pr	Me	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ik-17	COOH	Et	Pr	H	4-OMe-C ₆ H ₄

(表 3 0)



No	R ¹	R ¹³	Z ¹⁴	Y	Ar
Ik-18	COOH	Et	Pr	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ik-19	COOH	CH ₂ C ₆ H ₅	Me	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ik-20	COOH	CH ₂ C ₆ H ₅	Me	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ik-21	COOH	iBu	Me	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ik-22	COOH	nBu	Me	H	4-F-C ₆ H ₄
Ik-23	COOH	nBu	Me	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ik-24	COOH	nBu	Me	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ik-25	COOH	nBu	Me	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ik-26	COOH	iBu	Me	H	4-OMe-C ₆ H ₄
Ik-27	COOH	iBu	Me	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ik-28	COOH	Pr	Me	Et	4-OMe-C ₆ H ₄
Ik-29	COOH	Pr	Me	Me	4-OH-C ₆ H ₄
Ik-30	COOH	CH ₂ C ₆ H ₅	Me	H	4-F-C ₆ H ₄
Ik-31	COOH	Pr	Me	Me	4-OEt-C ₆ H ₄
Ik-32	COOH	Pr	Me	proprgyl	4-OMe-C ₆ H ₄
Ik-33	COOH	CH ₂ C ₆ H ₅	Me	proprgyl	4-OMe-C ₆ H ₄
Ik-34	COOH	iBu	Me	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ik-35	COOH	OMe	Me	Me	4-F-C ₆ H ₄
Ik-36	COOH	OMe	Me	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ik-37	COOH	C(=O)Et	Me	Me	4-OMe-C ₆ H ₄
Ik-38	COOH	C(=O)Et	Me	Et	4-OMe-C ₆ H ₄
Ik-39	COOH	Pr	Me	Me	C ₆ H ₅
Ik-40	COOH	Pr	Me	Me	4-Me-C ₆ H ₄
Ik-41	COOH	Pr	Me	Me	2-F-C ₆ H ₄
Ik-42	COOH	Pr	Me	Me	4-Cl-C ₆ H ₄
Ik-43	COOH	Pr	Me	Me	4-Br-C ₆ H ₄

物理恒数を以下の表に示す。

(表 3 1)

化合物 番号	物性値
Ia-7	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.95 (m, 2H), 3.28 (m, 2H), 4.62 (br, 1H), 4.81 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.06-7.22 (m, 3H), 7.38-7.72 (m, 4H), 7.71-7.74 (m, 2H); IR (CHCl ₃) 3480, 2953, 1731, 1603, 1469, 1447, 1409, 1329, 1162, 1093 cm ⁻¹ ;
Ia-8	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.95 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 3.31 (dt, J = 5.4 and 6.3 Hz, 2H), 4.79 (t, J = 5.4 Hz, 1H), 4.84 (s, 2H), 6.90 (s, 1H), 6.99-7.22 (m, 5H), 7.41 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.50 (m, 1H), 7.86 (m, 1H); IR (CHCl ₃) 3482, 3374, 2929, 1732, 1601, 1475, 1453, 1411, 1384, 1335, 1266, 1169, 1156, 1126, 1077, 1015 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₈ H ₁₇ FN ₂ O ₄ S·0.4H ₂ O) 計算値 (%): C, 56.36; H, 4.68; N, 7.30; F, 4.95; S, 8.36 実測値 (%): C, 56.52; H, 4.67; N, 7.10; F, 4.69; S, 8.30
Ia-9	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.94 (m, 2H), 3.26 (m, 2H), 4.54 (t, J = 5.7 Hz, 1H), 6.86 (s, 1H), 6.97-7.27 (m, 6H), 7.37 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.65-7.69 (m, 2H), 7.71-7.74 (m, 2H); IR (KBr) 3422, 3290, 2929, 1731, 1592, 1494, 1469, 1408, 1382, 1328, 1292, 1237, 1166, 1152, 1092, 1013 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₈ H ₁₇ FN ₂ O ₄ S·0.5AcOEt) 計算値 (%): C, 57.13; H, 5.03; N, 6.66; F, 4.52; S, 7.63 実測値 (%): C, 57.36; H, 5.07; N, 6.94; F, 4.58; S, 7.35
Ia-12	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.92 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.21-3.25 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 4.50 (br, 1H), 4.80 (s, 2H), 6.80-6.82 (m, 3H), 7.06 (m, 1H), 7.18-7.23 (m, 2H), 7.39 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.60-7.65 (m, 2H); IR (CHCl ₃) 3481, 2967, 2945, 2842, 1732, 1598, 1580, 1498, 1468, 1441, 1409, 1330, 1260, 1155, 1096, 1047, 1030 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₉ H ₂₀ N ₂ O ₅ S·0.5AcOEt) 計算値 (%): C, 58.32; H, 5.59; N, 6.48; S, 7.41 実測値 (%): C, 57.95; H, 5.40; N, 6.61; S, 7.73
Ia-13	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.97 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 3.35 (m, 2H), 4.62 (t, J = 5.7 Hz, 1H), 4.82 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.00 (m, 1H), 7.11 (m, 1H), 7.19-7.26 (m, 2H), 7.43-7.51 (m, 3H); IR (CHCl ₃) 3360, 2930, 1732, 1469, 1407, 1382, 1334, 1158, 1092, 1069, 1048, 1016 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₆ H ₁₆ N ₂ O ₄ S ₂ ·0.4AcOEt) 計算値 (%): C, 52.89; H, 4.84; N, 7.01; S, 16.05 実測値 (%): C, 52.93; H, 4.88; N, 7.04; S, 16.01
Ia-14	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.94 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 3.30 (dt, J = 6.0 and 6.3 Hz, 2H), 4.61 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.07-7.27 (m, 5H), 7.42 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.84 (dd, J = 1.2 and 3.0 Hz, 1H); IR (CHCl ₃) 3481, 2930, 1732, 1469, 1410, 1331, 1157, 1101, 1076, 1015 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₆ H ₁₆ N ₂ O ₄ S·0.1AcOEt) 計算値 (%): C, 52.77; H, 4.54; N, 7.51; S, 17.18 実測値 (%): C, 52.39; H, 4.57; N, 7.40; S, 17.00

(表 3 2)

化合物 番号	物性値
Ia-15	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.96 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 3.29 (m, 2H), 4.56 (m, 1H), 4.81 (s, 2H), 6.88 (s, 1H), 7.03 (m, 1H), 7.13-7.21 (m, 4H), 7.39 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.51-7.55 (m, 4H), 7.73-7.76 (m, 2H); IR (CHCl ₃) 2930, 1732, 1604, 1519, 1469, 1408, 1331, 1160, 1096, 1047 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₁ FN ₂ O ₄ S·0.5AcOEt) 計算値 (%): C, 62.89; H, 5.07; N, 5.83; F, 3.83; S, 6.46 実測値 (%): C, 62.74; H, 4.97; N, 5.90; F, 3.82; S, 6.54
Ia-16	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.94 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 3.26 (m, 2H), 4.51 (br, 1H), 4.81 (s, 2H), 6.86-6.94 (m, 3H), 7.03-7.11 (m, 3H), 7.19-7.24 (m, 3H), 7.37-7.63 (m, 3H), 7.64-7.70 (m, 2H); IR (KBr) 3279, 3059, 2930, 1730, 1583, 1488, 1469, 1410, 1382, 1327, 1298, 1245, 1152, 1094, 1013 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₂ N ₂ O ₅ S·0.6AcOEt) 計算値 (%): C, 62.99; H, 5.37; N, 5.57; S, 6.37 実測値 (%): C, 62.99; H, 5.19; N, 5.77; S, 6.47
Ia-17	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.92 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 3.31 (m, 2H), 4.66 (m, 1H), 4.73 (s, 2H), 6.80 (s, 1H), 6.91 (m, 1H), 7.06-7.11 (m, 2H), 7.28 (m, 1H), 7.47-7.90 (m, 5H), 8.10 (dd, J = 2.7 and 6.3 Hz, 1H), 8.49 (s, 1H); IR (CHCl ₃) 3480, 2929, 1732, 1670, 1616, 1586, 1468, 1428, 1411, 1377, 1330, 1158, 1077, 1047, 1025, 1015 cm ⁻¹ ;
Ia-20	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.31 (s, 3H), 2.95 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.19 (dt, J = 6.0 and 6.3 Hz, 2H), 4.37 (t, J = 6.3 Hz, 1H), 4.82 (s, 2H), 6.98-7.18 (m, 5H), 7.30 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.63-7.68 (m, 2H); IR (CHCl ₃) 2926, 1730, 1594, 1495, 1410, 1375, 1335, 1292, 1167, 1154, 1093 cm ⁻¹
Ia-25	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.62 (s, 3H), 2.90 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 3.22 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 4.53 (br, 1H), 5.03 (s, 2H), 6.74 (s, 1H), 6.93-7.03 (m, 4H), 7.19 (m, 1H), 7.64-7.69 (m, 2H); IR (CHCl ₃) 2940, 1729, 1594, 1495, 1465, 1438, 1408, 1373, 1329, 1292, 1167, 1154, 1093, 1074, 1046, 1014 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₉ H ₁₉ FN ₂ O ₄ S·0.5H ₂ O) 計算値 (%): C, 57.13; H, 5.05; N, 7.01; F, 4.76; S, 8.03 実測値 (%): C, 57.15; H, 4.99; N, 6.74; F, 4.42; S, 7.72
Ia-28	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.87-2.92 (m, 2H), 3.19-3.24 (m, 2H), 3.79 (s, 3H), 4.59 (br, 1H), 4.77 (s, 2H), 6.78-7.11 (m, 6H), 6.63-7.68 (m, 2H); IR (CHCl ₃) 2942, 2837, 1731, 1622, 1594, 1492, 1455, 1409, 1333, 1292, 1167, 1153, 1093, 1051, 1014 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₉ H ₁₉ FN ₂ O ₅ S·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 55.66; H, 4.77; N, 6.83; F, 4.63; S, 7.82 実測値 (%): C, 55.52; H, 4.87; N, 6.54; F, 4.45; S, 7.55
Ia-32	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.87 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 3.20-3.22 (m, 2H), 4.58 (br, 1H), 4.77 (s, 2H), 6.89 (s, 1H), 6.98-7.18 (m, 5H), 7.62-7.67 (m, 2H); IR (CHCl ₃) 3477, 2930, 1731, 1594, 1495, 1471, 1409, 1376, 1333, 1293, 1167, 1154, 1093, 1073, 1046, 1014 cm ⁻¹

(表 3 3)

化合物 番号	物性値
Ia-36	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.90 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.23 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 4.44 (br, 1H), 4.83 (s, 2H), 6.93-7.13 (m, 6H), 7.68-7.72 (m, 2H); IR (KBr) 3290, 2664, 2573, 1721, 1629, 1591, 1493, 1460, 1440, 1410, 1346, 1323, 1292, 1252, 1090, 1049, cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₈ H ₁₆ F ₂ N ₂ O ₄ S·0.2AcOEt) 計算値 (%): C, 54.80; H, 4.31; N, 6.80; F, 9.22; S, 7.78 実測値 (%): C, 54.70; H, 4.27; N, 6.68; F, 9.03; S, 7.81
Ia-39	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.79 (s, 3H), 3.03 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.34 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 4.85 (s, 2H), 6.95 (s, 1H), 7.12-7.23 (m, 5H), 7.55 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.74-7.79 (m, 2H); IR (CHCl ₃) 3482, 2928, 2865, 1732, 1594, 1495, 1469, 1408, 1383, 1341, 1292, 1166, 1154, 1189, 1044, 1014 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₉ H ₁₉ FN ₂ O ₄ S·0.1AcOEt) 計算値 (%): C, 58.36; H, 5.00; N, 7.02; F, 4.76; S, 8.03 実測値 (%): C, 58.64; H, 5.07; N, 6.90; F, 4.46; S, 7.90
Ia-41	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.35 (s, 3H), 2.78 (s, 3H), 3.02 (t, J = 8.4 Hz, 2H), 3.22 (t, J = 8.4 Hz, 2H), 4.83 (s, 2H), 7.09-7.17 (m, 5H), 7.47 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.72-7.77 (m, 2H); IR (CHCl ₃) 2928, 2866, 1906, 1731, 1594, 1496, 1469, 1416, 1376, 1341, 1292, 1166, 1154, 1090, 1046, 1013 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₂₁ FN ₂ O ₄ S·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 58.61; H, 5.31; N, 6.83; F, 4.64; S, 7.82 実測値 (%): C, 58.58; H, 5.11; N, 6.61; F, 4.32; S, 7.46
Ia-42	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.62 (s, 3H), 2.78 (s, 3H), 2.99 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 3.32 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 5.06 (s, 2H), 6.83 (s, 1H), 6.95-7.17 (m, 4H), 7.37 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.74-7.78 (m, 2H); IR (CHCl ₃) 2933, 2869, 1731, 1594, 1495, 1463, 1439, 1406, 1375, 1342, 1292, 1166, 1154, 1089, 1044, 1014 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₂₁ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 59.39; H, 5.23; N, 6.93; F, 4.70; S, 7.93 実測値 (%): C, 59.28; H, 5.26; N, 6.75; F, 4.45; S, 7.66
Ia-43	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.79 (s, 3H), 3.00 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 3.33 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 3.86 (s, 3H), 4.81 (s, 2H), 6.88-7.18 (m, 6H), 7.75-7.79 (m, 2H); IR (CHCl ₃) 2930, 1731, 1594, 1490, 1455, 1342, 1166, 1154, 1089, 1045, 1014 cm ⁻¹
Ia-44	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.78 (s, 3H); 2.98 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 3.32 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 4.83 (s, 2H), 7.01 (s, 1H), 7.11-7.20 (m, 3H), 7.47 (s, 1H), 7.74-7.79 (m, 2H); IR (CHCl ₃) 3481, 2928, 2864, 1732, 1594, 1496, 1471, 1342, 1293, 1241, 1166, 1154, 1089, 1072, 1041, 1014 cm ⁻¹
Ia-45	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.78 (s, 3H), 2.97 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 3.31 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 4.83 (s, 2H), 6.97-7.19 (m, 6H), 7.75-7.79 (m, 2H); IR (KBr) 2927, 1730, 1626, 1592, 1489, 1458, 1338, 1293, 1236, 1153, 1087, 1039, 1013 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₉ H ₁₈ F ₂ N ₂ O ₄ S·0.7MeOH) 計算値 (%): C, 54.92; H, 4.87; N, 6.50; F, 8.82; S, 7.44 実測値 (%): C, 55.19; H, 4.93; N, 6.33; F, 8.44; S, 7.24

(表 3 4)

化合物 番号	物性値
Ia-47	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.98-3.03 (m, 2H), 3.38-3.43 (m, 2H), 3.84 (d, $J = 6.3\text{Hz}$, 2H), 4.01 (s, 2H), 5.13-5.18 (m, 2H), 5.64 (m, 1H), 6.81 (s, 1H), 7.07-7.15 (m, 3H), 7.17-7.24 (m, 2H), 7.54 (d, $J = 7.8\text{Hz}$, 1H), 7.76-7.82 (m, 2H); IR (CHCl_3) 3503, 2928, 2869, 2656, 2558, 1770, 1733, 1594, 1495, 1469, 1342, 1291, 1165, 1153 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{21}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 59.79; H, 5.16; F, 4.50; N, 6.64; S, 7.60 実測値 (%): C, 59.83; H, 4.91; F, 4.42; N, 6.67; S, 7.52
Ia-48	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.05 (s, 3H), 1.07 (s, 3H), 3.12-3.18 (m, 2H), 3.31-3.36 (m, 2H), 4.11 (m, 1H), 4.85 (s, 2H), 6.92 (s, 1H), 7.11-7.26 (m, 5H), 7.68 (d, $J = 7.5\text{Hz}$, 1H), 7.83-7.88 (m, 2H); IR (CHCl_3) 3503, 2935, 2875, 2653, 2558, 1733, 1594, 1494, 1468, 1334, 1291, 1187, 1150 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{23}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 59.76; H, 5.59; F, 4.50; N, 6.64; S, 7.60 実測値 (%): C, 59.80; H, 5.44; F, 4.48; N, 6.65; S, 7.62
Ia-51	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.82 (dd, $J = 8.1$ and 5.1Hz , 2H), 3.36 (dd, $J = 8.1$ and 5.1Hz , 2H), 4.37 (s, 2H), 4.77 (s, 2H), 6.69 (s, 1H), 7.05-7.30 (m, 11H), 7.79-7.84 (m, 2H); IR (CHCl_3) 3282, 2928, 2871, 1732, 1594, 1496, 1469, 1407, 1384, 1339, 1292, 1165, 1154, 1093, 1068, 1014 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{23}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.8\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 62.43; H, 5.16; N, 5.82; F, 3.95; S, 6.67 実測値 (%): C, 62.43; H, 5.39; N, 5.64; F, 3.70; S, 6.38
Ia-52	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.65 (t, $J = 7.8\text{Hz}$, 2H), 3.24-3.28 (m, 2H), 3.36 (s, 3H), 4.45 (s, 2H), 4.49 (s, 2H), 6.87-7.45 (m, 12H), 7.90-7.95 (m, 2H); IR (KBr) 3434, 2926, 1592, 1494, 1469, 1405, 1380, 1335, 1293, 1234, 1152, 1069, 1013 cm^{-1} ;
Ia-55	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.13 (s, 3H), 2.78 (t, $J = 8.1\text{Hz}$, 2H), 3.19 (t, $J = 8.1\text{Hz}$, 2H), 4.36 (s, 2H), 4.75 (s, 2H), 7.03-7.37 (m, 11H), 7.82-7.87 (m, 2H); IR (CHCl_3) 2928, 2868, 1659, 1594, 1496, 1469, 1340, 1292, 1165, 1154, 1097, 1015 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{25}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 64.98; H, 5.24; N, 5.83; F, 3.95; S, 6.67 実測値 (%): C, 65.28; H, 5.24; N, 5.59; F, 3.64; S, 6.31
Ia-56	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.58 (s, 3H), 2.79 (t, $J = 7.8\text{Hz}$, 2H), 3.35 (t, $J = 7.8\text{Hz}$, 2H), 4.37 (s, 2H), 4.98 (s, 2H), 6.57 (s, 1H), 6.90-7.37 (m, 10H), 7.79-7.89 (m, 2H); IR (CHCl_3) 3482, 2934, 2871, 1731, 1594, 1496, 1455, 1439, 1406, 1341, 1292, 1165, 1154, 1093, 1070, 1029, 1013 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{25}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 64.98; H, 5.24; N, 5.83; F, 3.95; S, 6.67 実測値 (%): C, 64.81; H, 5.26; N, 5.60; F, 3.75; S, 6.47
Ia-57	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.79 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 3.36 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 3.79 (s, 3H), 4.37 (s, 2H), 4.73 (s, 2H), 6.66 (s, 1H), 6.78-7.38 (m, 10H), 7.80-7.84 (m, 2H); IR (CHCl_3) 2937, 1732, 1593, 1491, 1455, 1340, 1292, 1165, 1154, 1093, 1066, 1043, 1014 cm^{-1} ;

(表 3 5)

化合物 番号	物性値
Ia-58	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.77 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 3.31 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.36 (s, 2H), 4.75 (s, 2H), 6.74 (s, 1H), 7.04-7.32 (m, 10H), 7.81-7.86 (m, 2H); IR (CHCl_3) 3481, 2929, 2868, 1732, 1594, 1496, 1471, 1410, 1386, 1341, 1292, 1165, 1154, 1093, 1071, 1029, 1013 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{22}\text{ClNF}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 59.94; H, 4.43; N, 5.59; Cl, 7.08; F, 3.79; S, 6.40 実測値 (%): C, 59.65; H, 4.34; N, 5.48; Cl, 6.71; F, 3.62; S, 6.19
Ia-59	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.77 (t, $J = 8.1$ Hz, 2H), 3.32 (t, $J = 8.1$ Hz, 2H), 4.36 (s, 2H), 4.76 (s, 2H), 6.76 (s, 1H), 6.80-7.37 (m, 11H), 7.81-7.86 (m, 2H); IR (KBr) 3429, 2927, 1733, 1625, 1594, 1486, 1455, 1408, 1338, 1295, 1241, 1209, 1199, 1166, 1154, 1137, 1097, 1070, 1028, 1014 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{22}\text{F}_2\text{N}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.3\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 61.59; H, 4.81; N, 5.48; F, 7.44; S, 6.28 実測値 (%): C, 61.98; H, 4.83; N, 5.31; F, 7.12; S, 6.13
Ia-61	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.36 (s, 3H), 2.67-2.72 (m, 2H), 3.23-3.29 (m, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.74 (s, 2H), 5.70 (br s, 1H), 6.63 (s, 1H), 7.03 (m, 1H), 7.11-7.27 (m, 9H), 7.81-7.88 (m, 2H); IR (CHCl_3) 3502, 2929, 2868, 2656, 2558, 1732, 1594, 1495, 1468, 1340, 1240 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{25}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 64.50; H, 5.29; F, 3.92; N, 5.79; S, 6.62 実測値 (%): C, 64.50; H, 5.24; F, 3.78; N, 5.82; S, 6.61
Ia-62	mp 108-110 $^{\circ}\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.75-2.80 (m, 2H), 3.28-3.34 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 4.27 (s, 2H), 4.64 (s, 2H), 6.13 (br s, 1H), 6.63 (s, 1H), 6.80-6.82 (m, 2H), 7.00-7.15 (m, 7H), 7.24 (m, 1H), 7.75-7.80 (m, 2H); IR (Nujol) 2726, 1727, 1612, 1590, 1513, 1494, 1467, 1333, 1246, 1152 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{25}\text{FN}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 62.21; H, 5.14; F, 3.78; N, 5.58; S, 6.39 実測値 (%): C, 62.26; H, 5.16; F, 3.56; N, 5.43; S, 6.21
Ia-63	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.86 (t, $J = 7.4$ Hz, 2H), 3.42 (t, $J = 7.4$ Hz, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.80 (s, 2H), 5.35 (br s, 1H), 6.74 (s, 1H), 7.01 (m, 1H), 7.14-7.32 (m, 7H), 7.83-7.87 (m, 2H), 7.98-8.01 (m, 2H); IR (Nujol) 2725, 1725, 1591, 1520, 1493, 1465, 1377, 1345, 1235, 1153 cm^{-1}
Ia-64	mp 163-165 $^{\circ}\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.50-2.56 (m, 2H), 3.24-3.30 (m, 2H), 4.64 (s, 2H), 4.75 (s, 2H), 6.48 (s, 1H), 6.95-7.07 (m, 3H), 7.11-7.22 (m, 3H), 7.32-7.40 (m, 2H), 7.49-7.59 (m, 2H), 7.81-7.93 (m, 4H), 8.29-8.32 (m, 2H); IR (Nujol) 3105, 3061, 1736, 1592, 1492, 1465, 1343, 1333, 1239, 1221, 1170, 1152 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{29}\text{H}_{25}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 67.43; H, 4.88; F, 3.68; N, 5.42; S, 6.21 実測値 (%): C, 67.20; H, 4.71; F, 3.51; N, 5.30; S, 6.04

(表 3 6)

化合物 番号	物性値
Ia-65	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.94-2.99 (m, 2H), 3.41-3.46 (m, 2H), 4.57 (s, 2H), 4.79 (s, 2H), 6.77-6.90 (m, 3H), 7.06-7.25 (m, 6H), 7.41 (d, $J = 7.8\text{Hz}$, 1H), 7.75-7.79 (m, 2H); IR (CHCl_3) 3503, 2929, 2655, 2558, 1733, 1594, 1495, 1469, 1342 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{21}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}_2 \cdot 0.6\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 57.15; H, 4.63; F, 3.93; N, 5.80; S, 13.27 実測値 (%): C, 57.04; H, 4.48; F, 3.78; N, 5.63; S, 13.44
Ia-66	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.82 (t, $J = 8.0\text{Hz}$, 2H), 2.97-3.02 (m, 2H), 3.35-3.48 (m, 4H), 4.79 (s, 2H), 5.99 (bs, 1H), 6.83 (s, 1H), 7.05-7.28 (m, 10H), 7.54 (d, $J = 7.5\text{Hz}$, 1H), 7.73-7.78 (m, 2H); IR (CHCl_3) 3503, 2932, 2869, 2655, 2558, 1733, 1594, 1496, 1468, 1334 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{25}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 63.79; H, 5.35; F, 3.88; N, 5.72; S, 6.55 実測値 (%): C, 64.02; H, 5.29; F, 3.60; N, 5.75; S, 6.26
Ia-69	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.86 (m, 2H), 2.75 (t, $J = 6.3\text{Hz}$, 2H), 3.00 (m, 2H), 4.58 (t, $J = 5.7\text{Hz}$, 1H), 4.83 (s, 2H), 6.83 (s, 1H), 7.06-7.24 (m, 5H), 7.45 (d, $J = 7.8\text{Hz}$, 1H), 7.70-7.75 (m, 2H); IR (CHCl_3) 3780, 3369, 2936, 1732, 1594, 1495, 1468, 1410, 1381, 1334, 1292, 1240, 1167, 1154, 1093, 1046, 1014 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.2\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 58.28; H, 5.09; N, 6.87; F, 4.66; S, 7.86 実測値 (%): C, 58.39; H, 5.14; N, 6.96; F, 4.52; S, 7.72
Ia-74	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.83-1.91 (m, 2H), 2.75 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 2.97-3.04 (m, 2H), 4.56 (m, 1H), 4.82 (s, 2H), 6.82 (s, 1H), 6.95-7.12 (m, 5H), 7.19-7.25 (m, 3H), 7.34-7.49 (m, 3H), 7.67-7.75 (m, 2H); IR (CHCl_3) 3480, 2935, 1732, 1584, 1488, 1469, 1412, 1376, 1332, 1298, 1246, 1154, 1095, 1045, 1022 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{24}\text{N}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 63.90; H, 5.28; N, 5.96; S, 6.82 実測値 (%): C, 63.95; H, 5.51; N, 5.72; S, 6.39
Ia-81	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.91 (m, 2H), 2.73 (s, 3H), 2.81 (t, $J = 6.9\text{Hz}$, 2H), 3.60 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 1H), 4.86 (s, 2H), 6.95 (s, 1H), 7.10-7.23 (m, 5H), 7.54 (d, $J = 7.8\text{Hz}$, 1H), 7.73 (m, 2H); IR (CHCl_3) 3481, 2932, 2868, 1731, 1615, 1594, 1494, 1468, 1407, 1378, 1342, 1292, 1166, 1154, 1090, 1014 cm^{-1}
Ia-85	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.68-1.77 (m, 2H), 2.56 (t, $J = 6.9\text{Hz}$, 2H), 3.17 (t, $J = 7.8\text{Hz}$, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.80 (s, 2H), 6.67 (s, 1H), 7.03-7.38 (m, 11H), 7.71-7.77 (m, 2H); IR (CHCl_3) 3481, 2931, 1732, 1594, 1495, 1468, 1339, 1292, 1165, 1154, 1095, 1013 cm^{-1}
Ia-87	mp 125-126 $^{\circ}\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.39 (s, 3H), 2.81 (m, 1H), 2.99 (m, 1H), 3.33-3.46 (m, 2H), 4.82 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.06-7.28 (m, 10H), 7.55 (d, $J = 8.1\text{Hz}$, 1H), 7.68 (d, $J = 8.4\text{Hz}$, 2H); IR (Nujol) 3428, 3081, 3026, 2927, 1713, 1598, 1468, 1325, 1241, 1191, 1149 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 68.04; H, 5.92; N, 5.88; S, 6.73 実測値 (%): C, 68.07; H, 5.82; N, 5.95; S, 6.60

(表 3 7)

化合物 番号	物性値
1a-88	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.89 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 3.21-3.27 (m, 2H), 4.53 (t, $J = 6.6$ Hz, 1H), 4.81 (s, 2H), 6.92-7.02 (m, 3H), 7.13 (m, 1H), 7.30-7.34 (m, 2H), 7.59-7.62 (m, 2H); IR (KBr) 3290, 3087, 2571, 1721, 1627, 1586, 1490, 1409, 1346, 1323, 1251, 1225, 1163, 1092, 1048, 1013 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{18}\text{H}_{26}\text{ClFN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 52.62; H, 3.93; N, 6.82; Cl, 8.63; F, 4.62; S, 7.80 実測値 (%): C, 52.46; H, 3.85; N, 6.62; Cl, 8.25; F, 4.34; S, 7.64
1a-89	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.85 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 3.19 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 4.56 (br, 1H), 4.77 (s, 2H), 6.80-6.98 (m, 5H), 7.10 (m, 1H), 7.58-7.64 (m, 2H); IR (CHCl_3) 2945, 2843, 1732, 1598, 1580, 1498, 1488, 1458, 1410, 1329, 1303, 1260, 1180, 1155, 1096, 1029 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 55.17; H, 4.82; N, 6.77; F, 4.59; S, 7.75 実測値 (%): C, 55.30; H, 4.81; N, 6.56; F, 4.33; S, 7.45
1a-90	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.91 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.34-3.49 (m, 2H), 4.63 (t, $J = 6.0$ Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 6.92-7.15 (m, 5H), 7.48-7.53 (m, 2H); IR (KBr) 3269, 2655, 2565, 1728, 1626, 1584, 1488, 1459, 1433, 1324, 1241, 1096, 1073, 1017 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{16}\text{H}_{15}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 49.55; H, 4.05; N, 7.22; F, 4.90; S, 16.54 実測値 (%): C, 49.89; H, 3.98; N, 6.98; F, 4.54; S, 16.12
1a-91	mp 95-97°C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.84 (m, 1H), 3.02 (m, 1H), 3.34-3.49 (m, 2H), 4.83 (s, 2H), 6.88 (s, 1H), 7.04-7.29 (m, 9H), 7.52-7.59 (m, 3H); IR (Nujol) 3429, 3087, 3029, 2932, 1713, 1615, 1469, 1406, 1340, 1242, 1190, 1151 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{24}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 61.52; H, 5.16; N, 5.98; S, 13.69 実測値 (%): C, 61.39; H, 5.06; N, 5.78; S, 13.66
1a-92	mp 113-114.5 °C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.81 (m, 1H), 2.93 (m, 1H), 3.35-3.42 (m, 2H), 4.79 (s, 2H), 6.88 (s, 1H), 7.07-7.29 (m, 9H), 7.45 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.77 (dd, $J = 5.1, 8.7$ Hz); IR (Nujol) 3423, 3028, 1720, 1591, 1494, 1470, 1405, 1336, 1293, 1226, 1147, 1094 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{24}\text{ClFN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 60.64; H, 4.70; N, 5.44; Cl, 6.88; F, 3.69; S, 6.23 実測値 (%): C, 60.54; H, 4.60; N, 5.29; Cl, 6.70; F, 3.56; S, 6.28
1a-93	mp 103-107 °C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 3.05 (m, 2H), 3.45 (m, 2H), 3.96 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 4.77 (s, 2H), 5.94 (dt, $J = 6.6, 15.6$ Hz), 6.37 (d, $J = 15.6$ Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.01-7.33 (m, 10H), 7.49 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.82 (dd, $J = 4.8, 8.7$ Hz, 2H); IR (Nujol) 3456, 3058, 1725, 1591, 1493, 1469, 1405, 1334, 1292, 1235, 1165, 1153, 1091 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{25}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O} \cdot 0.3\text{MeOH}$) 計算値 (%): C, 64.60; H, 5.32; N, 5.52; F, 3.74; S, 6.32 実測値 (%): C, 64.58; H, 5.33; N, 5.47; F, 3.69; S, 6.53

(表 3 8)

化合物 番号	物性値
la-94	mp 126-129 °C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.85 (m, 1H), 2.58 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 2.99 (m, 2H), 3.19 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 3.39 (m, 2H), 4.80 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.07-7.29 (m, 10H), 7.50 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.75 (dd, $J = 5.1, 9.0$ Hz, 2H); IR (Nujol) 3404, 3056, 1724, 1591, 1492, 1471, 1413, 1340, 1290, 1232, 1154, 1095 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{27}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 65.57; H, 5.50; N, 5.66; F, 3.84; S, 6.48 実測値 (%): C, 65.48; H, 5.60; N, 5.56; F, 3.77; S, 6.35
la-95	$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD) δ 2.39 (s, 3H), 2.80 (t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 3.10-3.16 (m, 2H), 6.89 (m, 1H), 6.98-7.29 (m, 5H), 7.63-7.66 (m, 2H); IR (KBr) 3293, 2575, 1721, 1628, 1598, 1491, 1459, 1440, 1407, 1321, 1252, 1224, 1187, 1092, 1048 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 57.91; H, 4.96; N, 7.11; F, 4.82; S, 8.14 実測値 (%): C, 57.87; H, 4.98; N, 6.85; F, 4.66, S, 7.93
la-96	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.86 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.25-3.32 (m, 2H), 4.64 (br, 1H), 4.74 (s, 2H), 6.85-7.09 (m, 4H), 7.57-7.66 (m, 3H), 7.81-7.89 (m, 3H), 8.33 (s, 1H); IR (KBr) 3281, 1713, 1625, 1588, 1487, 1456, 1411, 1325, 1239, 1216, 1157, 1132, 1102, 1075 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 61.18; H, 4.57; N, 6.49; F, 4.40; S, 7.42 実測値 (%): C, 61.08; H, 4.56; N, 6.22; F, 4.09, S, 7.14
la-97	$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD) δ 2.82 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.26-3.44 (m, 2H), 4.63 (t, $J = 6.0$ Hz, 1H), 6.76-7.13 (m, 4H), 7.76-7.81 (m, 2H), 8.06-8.10 (m, 2H); IR (KBr) 3280, 3104, 2938, 1721, 1626, 1606, 1583, 1526, 1487, 1410, 1349, 1310, 1254, 1225, 1164, 1092, 1047 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{18}\text{H}_{16}\text{FN}_3\text{O}_6\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 50.87; H, 3.89; N, 9.89; F, 4.47; S, 7.54 実測値 (%): C, 50.99; H, 3.86; N, 9.59; F, 4.19, S, 7.31
la-98	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.73 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.18-3.22 (m, 2H), 4.71 (t, $J = 6.0$ Hz, 1H), 6.63 (s, 1H), 6.81-7.05 (m, 3H), 7.45-7.53 (m, 3H), 7.89 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 8.03 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 8.22 (d, $J = 5.4$ Hz, 1H), 8.40 (d, $J = 5.4$ Hz, 1H); IR (CDCl_3) 1732, 1487, 1457, 1408, 1328, 1162, 1135, 1079, 1045 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 60.68; H, 4.63; N, 6.43; F, 4.36; S, 7.36 実測値 (%): C, 60.65; H, 4.58; N, 6.26; F, 4.10, S, 7.20
la-99	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.88 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.24-3.28 (m, 2H), 4.35 (br, 1H), 4.78 (s, 2H), 6.92-7.13 (m, 4H), 7.63 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 7.79 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H); IR (KBr) 3269, 2655, 2565, 1728, 1626, 1584, 1488, 1459, 1433, 1324, 1241, 1096, 1073, 1017 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{16}\text{FN}_3\text{O}_4\text{S}_2 \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 55.85; H, 4.14; N, 10.28; F, 4.65; S, 7.85 実測値 (%): C, 55.91; H, 4.23; N, 9.89; F, 4.33, S, 7.40

(表 3 9)

化合物 番号	物性値
la-100	$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ 2.68 (t, $J = 6.9$ Hz, 2H), 2.93-2.98 (m, 2H), 4.09 (br, 1H), 4.81 (s, 2H), 6.59 (dd, $J = 6.0$ and 2.1 Hz, 1H), 6.70 (s, 1H), 7.00 (s, 1H), 7.09 (d, $J = 6.0$ Hz, 1H), 7.36-7.42 (m, 2H), 7.78-7.87 (m, 3H), 8.70 (s, 1H); IR (KBr) 3431, 2927, 1732, 1626, 1591, 1494, 1465, 1407, 1322, 1292, 1231, 1151, 1092, cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{18}\text{H}_{17}\text{FN}_2\text{O}_5\text{S}\cdot\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 52.68; H, 4.67; N, 6.83; F, 4.63; S, 7.81 実測値 (%): C, 52.41; H, 4.72; N, 6.58; F, 4.38; S, 7.76
la-101	$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD) δ 2.91 (t, $J = 6.9$ Hz, 2H), 3.21 (t, $J = 6.9$ Hz, 2H), 6.63 (m, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.04-7.13 (m, 4H), 7.71-7.77 (m, 2H); IR (KBr) 3303, 1721, 1633, 1592, 1557, 1494, 1466, 1440, 1409, 1327, 1290, 1253, 1235, 1190, 1166, 1152, 1092, 1076, 1046 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{18}\text{H}_{16}\text{F}_2\text{N}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 54.82; H, 4.09; N, 7.10; F, 9.63; S, 8.13 実測値 (%): C, 54.63; H, 4.05; N, 6.97; F, 9.28; S, 7.87
la-102	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.79 (s, 3H), 3.08 (t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 3.35 (t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 4.83 (s, 2H), 6.74 (m, 1H), 6.92-7.17 (m, 5H), 7.74-7.79 (m, 2H); IR (CHCl_3) 2931, 1732, 1630, 1594, 1557, 1496, 1460, 1408, 1374, 1341, 1292, 1238, 1166, 1154, 1089, 1045 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{F}_2\text{N}_2\text{O}_4\text{S}\cdot 0.4\text{MeOH}$) 計算値 (%): C, 55.32; H, 4.69; N, 6.65; F, 9.02; S, 7.61 実測値 (%): C, 55.52; H, 4.50; N, 6.45; F, 8.70; S, 7.31
la-103	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.87 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 3.43 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.60 (s, 2H), 6.62-7.36 (m, 12H), 7.77-7.81 (m, 2H); IR (CHCl_3) 2930, 1732, 1629, 1593, 1496, 1457, 1406, 1329, 1292, 1154, 1098 cm^{-1} .
la-104	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.83 (d, $J = 7.2$ Hz, 3H), 2.79-2.94 (m, 2H), 3.19-3.49 (m, 2H), 4.55 (br, 1H), 5.07 (q, $J = 7.5$ Hz, 1H), 6.99-7.20 (m, 5H), 7.63-7.68 (m, 2H); IR (CHCl_3) 1725, 1594, 1495, 1466, 1409, 1331, 1292, 1167, 1153, 1092, 1062 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{ClFN}_2\text{O}_4\text{S}\cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 52.60; H, 4.41; N, 6.46; Cl, 8.17; F, 4.38; S, 7.39 実測値 (%): C, 52.64; H, 4.36; N, 6.35; Cl, 7.95; F, 4.29; S, 7.42
la-105	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.84 (d, $J = 7.2$ Hz, 3H), 2.97 (t, $J = 8.1$ Hz, 2H), 3.31 (t, $J = 8.1$ Hz, 2H), 5.07 (q, $J = 7.2$ Hz, 1H), 7.13-7.19 (m, 5H), 7.46 (s, 1H), 7.75-7.80 (m, 2H); IR (CHCl_3) 1726, 1594, 1495, 1465, 1375, 1342, 1292, 1166, 1154, 1090 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{20}\text{H}_{20}\text{ClFN}_2\text{O}_4\text{S}\cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 54.07; H, 4.67; N, 6.30; Cl, 7.98; F, 4.28; S, 7.22 実測値 (%): C, 54.09; H, 4.89; N, 5.99; Cl, 7.63; F, 4.03; S, 6.86
la-106	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.78 (d, $J = 7.5$ Hz, 3H), 2.77 (t, $J = 8.4$ Hz, 2H), 3.32 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 4.71 (s, 1H), 5.01 (q, $J = 7.5$ Hz, 1H), 6.91 (s, 1H), 7.08-7.738 (m, 10H), 7.82-7.87 (m, 2H); IR (CHCl_3) 1725, 1594, 1496, 1465, 1341, 1292, 1165, 1154, 1092, 1066 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{24}\text{ClFN}_2\text{O}_4\text{S}\cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 60.01; H, 4.76; N, 5.38; Cl, 6.81; F, 3.65; S, 6.16 実測値 (%): C, 60.24; H, 4.65; N, 5.25; Cl, 6.51; F, 3.55; S, 6.04

(表 4 0)

化合物 番号	物性値
Ib-2	$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ 2.54-2.68 (m, 2H), 2.89-3.06 (m, 2H), 3.35 (m, 1H), 4.84 (s, 2H), 6.93-7.04 (m, 2H), 7.26-7.32 (m, 2H), 7.45-7.52 (m, 2H), 7.92-7.97 (m, 2H), 8.36 (d, $J = 7.8\text{Hz}$, 1H), 12.96 (br, 1H); IR (KBr) 3429, 3300, 3061, 2913, 2856, 1725, 1592, 1494, 1458, 1432, 1409, 1382, 1340, 1291, 1241, 1167, 1155, 1092, 1002 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{17}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 57.68; H, 4.54; N, 7.08; F, 4.80; S, 8.11 実測値 (%): C, 57.89; H, 4.36; N, 6.76; F, 4.49; S, 7.77
Ib-6	$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD) δ 2.56-2.65 (m, 2H), 2.71 (s, 3H), 2.95-3.04 (m, 2H), 4.75 (d, $J = 18\text{Hz}$, 1H), 4.80 (d, $J = 18\text{Hz}$, 1H), 5.36 (m, 1H), 6.96-7.08 (m, 2H), 7.19-7.41 (m, 4H), 7.93-7.98 (m, 2H); IR (KBr) 3413, 2925, 2653, 2551, 1719, 1706, 1616, 1592, 1493, 1461, 1404, 1378, 1335, 1291, 1234, 1151, 1087, 1012 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{20}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 0.4\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 59.27; H, 5.11; N, 6.40; F, 4.34; S, 7.33 実測値 (%): C, 59.03; H, 4.95; N, 6.34; F, 4.17; S, 7.29
Ib-11	$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD) δ 2.46-2.55 (m, 2H), 2.89-2.98 (m, 2H), 4.30 (d, $J = 7.2\text{Hz}$, 1H), 4.42 (d, $J = 7.2\text{Hz}$, 1H), 4.50 (d, 12.0 Hz, 1H), 4.63 (d, $J = 12.0\text{Hz}$, 1H), 5.36 (m, 1H), 6.95-7.39 (m, 11H), 7.96-8.01 (m, 2H); IR (KBr) 3430, 2927, 2859, 1728, 1591, 1493, 1457, 1404, 1381, 1340, 1292, 1236, 1208, 1165, 1153, 1092, 1052, 1012 cm^{-1} ;
Ib-16	mp 162-168 $^{\circ}\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ 1.77 (m, 1H), 1.92 (m, 1H), 2.46-2.78 (m, 4H), 3.41 (m, 1H), 4.80 (d, $J = 18.6\text{Hz}$, 1H), 4.86 (d, $J = 18.6\text{Hz}$, 1H), 6.96 (m, 1H), 7.04 (m, 1H), 7.25 (d, $J = 7.2\text{Hz}$, 1H), 7.29 (d, $J = 8.1\text{Hz}$, 1H), 7.40-7.48 (m, 2H), 7.90-7.97 (m, 3H), 12.95 (br, 1H); IR (Nujol) 3261, 1734, 1590, 1493, 1469, 1444, 1329, 1188, 1168, 1153 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{24} +60.4 \pm 1.0^{\circ}$ ($c=1.012$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{20}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 59.69; H, 4.76; F, 4.72; N, 6.96; S, 7.97 実測値 (%): C, 59.51; H, 4.68; F, 4.57; N, 6.77; S, 7.78
Ib-18	$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ 1.74 (m, 1H), 1.90 (m, 1H), 2.39 (s, 3H), 2.45-2.75 (m, 4H), 3.30 (m, 1H), 4.79 (d, $J = 19.2\text{Hz}$, 1H), 4.88 (d, $J = 19.2\text{Hz}$, 1H), 6.96 (m, 1H), 7.04 (m, 1H), 7.24 (d, $J = 6.9\text{Hz}$, 1H), 7.29 (d, $J = 7.8\text{Hz}$, 1H), 7.40 (d, $J = 8.1\text{Hz}$, 2H), 7.76 (d, $J = 8.1\text{Hz}$, 2H), 7.82 (d, $J = 6.6\text{Hz}$, 1H), 12.93 (br, 1H); IR (KBr) 3272, 2924, 1728, 1617, 1598, 1468, 1434, 1382, 1319, 1156 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{23} +76.2 \pm 1.2^{\circ}$ ($c=1.010$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 61.90; H, 5.69; N, 6.87; S, 7.87 実測値 (%): C, 62.01; H, 5.45; N, 6.81; S, 7.76

(表 4 1)

化合物 番号	物性値
Ib-20	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.78 (m, 1H), 1.94 (m, 1H), 2.48-2.80 (m, 4H), 3.47 (m, 1H), 4.81 (d, J = 18.3 Hz, 1H), 4.87 (d, J = 18.3 Hz, 1H), 6.97 (m, 1H), 7.05 (m, 1H), 7.19 (dd, J = 3.6, 5.1 Hz, 1H), 7.26-7.32 (m, 2H), 7.66 (dd, J = 1.5, 3.6 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 1.5, 5.1 Hz, 1H), 8.12 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 12.95 (br, 1H); IR (KBr) 3435, 3276, 2925, 1727, 1617, 1468, 1433, 1405, 1382, 1320, 1227, 1182, 1154 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +70.9±1.1° (c=1.010, MeOH); 元素分析 (C ₁₈ H ₁₈ N ₂ O ₄ S ₂ ·0.5H ₂ O) 計算値 (%): C, 54.12; H, 4.79; N, 7.01; S, 16.05 実測値 (%): C, 54.24; H, 4.58; N, 6.90; S, 16.14
Ib-21	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.77 (m, 1H), 1.95 (m, 1H), 2.46-2.76 (m, 4H), 3.40 (m, 1H), 4.80 (d, J = 18.6 Hz, 1H), 4.86 (d, J = 18.6 Hz, 1H), 6.96 (m, 1H), 7.04 (m, 1H), 7.26 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.41 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 7.78 (dd, J = 3.0, 5.1 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 8.20 (m, 1H), 12.95 (br, 1H); IR (KBr) 3271, 1728, 1616, 1468, 1433, 1382, 1319, 1206, 1183, 1153, 1101, 1075 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₈ H ₁₈ N ₂ O ₄ S ₂ ·0.4H ₂ O) 計算値 (%): C, 54.36; H, 4.76; N, 7.04; S, 16.13 実測値 (%): C, 54.36; H, 4.75; N, 6.92; S, 15.96
Ib-22	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.76 (m, 1H), 1.93 (m, 1H), 2.45-2.76 (m, 4H), 3.41 (m, 1H), 4.22 (s, 2H), 4.80 (d, J = 18.6 Hz, 1H), 4.86 (d, J = 18.6 Hz, 1H), 6.95-7.07 (m, 3H), 7.20-7.37 (m, 7H), 7.48 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 12.97 (br, 1H); IR (KBr) 3431, 3271, 2923, 1726, 1486, 1453, 1382, 1320, 1153 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₅ H ₂₄ FN ₂ O ₄ S ₂ ·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 61.78; H, 5.10; N, 5.76; S, 13.12 実測値 (%): C, 61.76; H, 5.01; N, 5.67; S, 13.12
Ib-25	mp 185-196 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.53 (m, 1H), 1.88 (m, 1H), 2.48-2.85 (m, 4H), 2.83 (s, 3H), 4.12 (m, 1H), 4.85 (s, 2H), 6.98 (m, 1H), 7.06 (m, 1H), 7.28-7.32 (m, 2H), 7.45-7.51 (m, 2H), 7.91-7.98 (m, 2H), 12.95 (br, 1H); IR (Nujol) 2683, 1715, 1592, 1490, 1465, 1473, 1335, 1288, 1167 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +95.0±1.3° (c=1.004, MeOH); 元素分析 (C ₂₀ H ₁₉ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 60.56; H, 5.08; F, 4.56; N, 6.73; S, 7.70 実測値 (%): C, 60.34; H, 5.15; F, 4.33; N, 6.47; S, 7.43
Ib-27	mp 154-160 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.50 (m, 1H), 1.85 (m, 1H), 2.42 (s, 3H), 2.52-2.78 (m, 4H), 2.80 (s, 3H), 4.10 (m, 1H), 4.82 (d, J = 18.3 Hz, 1H), 4.88 (d, J = 18.3 Hz, 1H), 6.97 (m, 1H), 7.05 (m, 1H), 7.28-7.32 (m, 2H), 7.51 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.75 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 12.95 (br, 1H); IR (Nujol) 2658, 1714, 1598, 1465, 1335, 1288, 1165 cm ⁻¹ ; [α] _D ²⁴ +119.5±1.6° (c=1.012, MeOH); 元素分析 (C ₂₂ H ₂₄ N ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 64.06; H, 5.86; N, 6.79; S, 7.77 実測値 (%): C, 64.02; H, 5.78; N, 6.75; S, 7.68

(表 4 2)

化合物 番号	物性値
Ib-29	Mp 185-196 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.52 (m, 1H), 1.88 (m, 1H), 2.53-2.82 (m, 4H), 2.86 (s, 3H), 4.11 (m, 1H), 4.82 (d, $J = 18.3$ Hz, 1H), 4.88 (d, $J = 18.3$ Hz, 1H), 6.98 (m, 1H), 7.06 (m, 1H), 7.26-7.33 (m, 3H), 7.74 (dd, $J = 1.5, 3.6$ Hz, 1H), 8.03 (dd, $J = 1.5, 5.1$ Hz, 1H), 12.93 (br, 1H); IR (Nujol) 2683, 1715, 1592, 1490, 1465, 1473, 1335, 1288, 1167 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{24} +95.0 \pm 1.3^\circ$ ($c=1.004$, MeOH); 元素分析 ($\text{C}_{20}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 60.56; H, 5.08; F, 4.56; N, 6.73; S, 7.70 実測値 (%): C, 60.34; H, 5.15; F, 4.33; N, 6.47; S, 7.43
Ib-30	mp 175-180 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.36 (m, 1H), 1.88 (m, 1H), 2.52 (m, 1), 2.64-2.86 (m, 3H), 2.83 (s, 3H), 4.11 (m, 1H), 4.85 (s, 2H), 6.98 (m, 1H), 7.06 (m, 1H), 7.28-7.32 (m, 2H), 7.45 (dd, $J = 1.2, 5.1$ Hz, 1H), 7.83 (dd, $J = 3.0, 5.1$ Hz, 1H), 8.31 (dd, $J = 1.2, 3.0$ Hz, 1H), 12.93 (br, 1H); IR (Nujol) 3100, 2662, 1721, 1468, 1336, 1323, 1253, 1201, 1163, 1138 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 56.42; H, 4.98; N, 6.93; S, 15.85 実測値 (%): C, 56.34; H, 4.88; N, 6.85; S, 15.80
Ib-31	mp 138-140 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.49 (m, 1H), 1.86 (m, 1H), 2.49-2.77 (m, 4H), 2.81 (s, 3H), 4.02 (m, 1H), 4.25 (s, 2H), 4.85 (s, 2H), 6.96-7.08 (m, 3H), 7.22-7.38 (m, 7H), 7.56 (d, $J = 3.9$ Hz, 1H), 12.97 (br, 1H); IR (Nujol) 1712, 1468, 1449, 1431, 1410, 1380, 1341, 1238, 1154 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{26}\text{H}_{26}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}_2$) 計算値 (%): C, 63.13; H, 5.30; N, 5.66; S, 12.97 実測値 (%): C, 62.99; H, 5.26; N, 5.56; S, 13.00
Ib-77	mp 160-172 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 2.50 (m, 1H), 2.80-3.06 (m, 6H), 4.18 (d, $J = 18.0$ Hz, 1H), 4.88 (d, $J = 18.0$ Hz, 1H), 6.94-7.04 (m, 2H), 7.27-7.31 (m, 2H), 7.41-7.48 (m, 2H), 7.85-7.91 (m, 3H), 12.95 (br, 1H); IR (Nujol) 3387, 3352, 2653, 1722, 1593, 1494, 1459, 1402, 1330, 1289, 1235, 1156 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{20}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 59.69; H, 4.76; F, 4.72; N, 6.96; S, 7.97 実測値 (%): C, 59.40; H, 4.74; F, 4.60; N, 7.04; S, 7.91
Ic-2	mp 142-143 °C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.42 (br s, 2H), 3.31 (t, $J = 5.7$ Hz, 2H), 3.97 (br s, 2H), 4.87 (s, 2H), 6.21 (br s, 1H), 7.03 (s, 1H), 7.14-7.29 (m, 5H), 7.75 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.85 (dd, $J = 4.8, 8.7$ Hz, 2H); IR (KBr) 3348, 1770, 1590, 1491, 1466, 1347, 1331, 1167, 1156, 1095 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 60.86; H, 4.62; N, 6.76; F, 4.58; S, 7.74 実測値 (%): C, 60.94; H, 4.65; N, 6.65; F, 4.24; S, 7.70
Ic-6	mp 189-194 °C (dec); $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.56 (m, 1H), 1.84 (m, 2H), 2.06 (m, 1H), 2.40-2.54 (m, 2H), 3.24 (m, 1H), 3.70 (m, 1H), 3.94 (dd, $J = 2.1, 11.7$ Hz, 1H), 4.84 (s, 2H), 6.88 (s, 1H), 7.13-7.26 (m, 5H), 7.63 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.76 (dd, $J = 5.1, 9.0$ Hz, 2H); IR (KBr) 3423, 1706, 1590, 1492, 1468, 1405, 1332, 1288, 1240, 1148 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{21}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 60.56; H, 5.08; N, 6.73; F, 4.56; S, 7.70 実測値 (%): C, 60.51; H, 5.12; N, 6.63; F, 4.35; S, 7.56

(表 4 3)

化合物 番号	物性値
Ic-8	mp 152-157 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.57 (m, 1H), 1.79-1.90 (m, 2H), 2.06 (m, 1H), 2.53-2.65 (m, 2H), 3.26 (m, 1H), 3.70 (m, 1H), 3.94 (m, 1H), 4.84 (s, 2H), 6.90 (s, 1H), 7.10-7.28 (4H, m), 7.51 (m, 1H), 7.58 (m, 1H), 7.64 (d, J = 7.8 Hz, 1H); IR (Nujol) 3424, 3101, 3055, 2930, 1717, 1614, 1579, 1469, 1406, 1337, 1243, 1164, 1146 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₉ H ₂₀ N ₂ O ₄ S ₂) 計算値 (%): C, 56.42; H, 4.98; N, 6.93; S, 15.85 実測値 (%): C, 56.37; H, 4.93; N, 6.83; S, 15.68
Ic-11	mp 212-214 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.41-1.96 (m, 4H), 2.27-2.42 (m, 2H), 3.06 (m, 1H), 3.64-3.84 (m, 2H), 4.94 (s, 2H), 6.97 (td, J = 2.7, 9.0 Hz, 1H), 7.23 (s, 1H), 7.31 (dd, J = 2.7, 10.2 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 4.5, 9.0 Hz, 1H), 7.42-7.48 (m, 2H), 7.80-7.86 (m, 2H); IR (Nujol) 2654, 2558, 1709, 1624, 1591, 1489, 1458, 1407, 1334, 1319, 1283, 1241, 1192, 1155 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₀ F ₂ N ₂ O ₄ S·0.2AcOEt) 計算値 (%): C, 57.92; H, 4.82; F, 8.40; N, 6.20; S, 7.09 実測値 (%): C, 58.06; H, 4.67; F, 8.24; N, 6.36; S, 7.31
Ic-14	mp 155-156 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.86 (m, 1H), 2.21 (m, 1H), 3.13 (dd, J = 8.4, 9.6 Hz, 1H), 3.29-3.51 (m, 3H), 3.73 (dd, J = 7.2, 9.6 Hz, 1H), 4.89 (s, 2H), 6.98 (m, 1H), 7.06 (s, 1H), 7.11 (m, 1H), 7.31 (m, 1H), 7.37 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H), 7.88-7.95 (m, 2H), 12.93 (br, 1H); IR (Nujol) 2662, 1732, 1712, 1587, 1490, 1469, 1341, 1333, 1241, 1198, 1162, 1095 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₁₉ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 59.69; H, 4.76; F, 4.72; N, 6.96; S, 7.97 実測値 (%): C, 59.55; H, 4.66; F, 4.54; N, 6.83; S, 7.93
Ic-16	mp 126-133 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.84 (m, 1H), 2.22 (m, 1H), 3.17 (dd, J = 8.7, 9.9 Hz, 1H), 3.33-3.55 (m, 3H), 3.76 (dd, J = 7.5, 9.9 Hz, 1H), 4.91 (s, 2H), 7.00 (m, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.12 (m, 1H), 7.28-7.40 (m, 3H), 7.75 (dd, J = 1.5, 3.9 Hz, 1H), 8.05 (dd, J = 1.5, 5.1 Hz, 1H), 12.92 (br, 1H); IR (Nujol) 3230, 1752, 1726, 1469, 1333, 1211, 1146, 1098, 1030 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₈ H ₁₈ N ₂ O ₄ S ₂ ·0.2AcOEt) 計算値 (%): C, 55.33; H, 4.84; N, 6.86; S, 15.71 実測値 (%): C, 55.08; H, 4.90; N, 6.83; S, 15.56
Ic-18	mp 139-140 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.84-2.16 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 3.30-3.76 (m, 5H), 4.88 (s, 2H), 6.77 (m, 2H), 7.02 (m, 1H), 7.31 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.50-7.64 (m, 2H), 7.94-8.08 (m, 2H); IR (Nujol) 3075, 2925, 2736, 2656, 2561, 1725, 1590, 1468, 1375, 1351, 1291, 1241, 1152 cm ⁻¹
Ic-22	mp 185-190 °C (dec); ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 2.65 (br t, 2H), 3.36 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 3.83 (br s, 2H), 4.78 (s, 2H), 6.10 (br s, 1H), 7.06 (s, 1H), 7.11-7.27 (m, 5H), 7.77 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.87 (dd, J = 5.1, 9.0 Hz, 2H); 元素分析 (C ₂₁ H ₁₉ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 60.86; H, 4.62; N, 6.76; F, 4.58; S, 7.74 実測値 (%): C, 60.59; H, 4.68; N, 6.57; F, 4.29; S, 7.46

(表 4 4)

化合物 番号	物性値
Ic-24	mp 119-124 °C (dec); ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.86 (m, 2H), 2.11 (m, 2H), 2.45 (m, 2H), 2.77 (m, 1H), 3.93 (m, 2H), 4.84 (s, 2H), 6.81 (s, 1H), 7.10 (m, 1H), 7.21-7.27 (m, 4H), 7.51 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.83 (dd, J = 5.1, 9.0 Hz, 2H); IR (KBr) 3422, 1715, 1593, 1493, 1467, 1349, 1333, 1240, 1168, 1154 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₁ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 60.56; H, 5.08; N, 6.73; F, 4.56; S, 7.70 実測値 (%): C, 60.48; H, 4.98; N, 6.67; F, 4.35; S, 7.55
Ic-26	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.43-1.71 (m, 4H), 2.89 (m, 1H), 3.08 (m, 1H), 3.34-3.49 (m, 2H), 3.92 (m, 1H), 4.86 (s, 2H), 6.93 (s, 1H), 7.15-7.26 (m, 5H), 7.79 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.87-7.91 (m, 2H); IR (KBr) 2927, 1727, 1591, 1493, 1468, 1332, 1292, 1235, 1197, 1152, 1091, 1038 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₁ FN ₂ O ₄ S·0.6H ₂ O) 計算値 (%): C, 59.03; H, 5.24; N, 6.56; F, 4.45; S, 7.50 実測値 (%): C, 59.38; H, 5.21; N, 6.42; F, 4.12; S, 7.11
Ic-29	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.26-1.65 (m, 6H), 2.97-3.21 (m, 3H), 3.82 (m, 1H), 4.36 (m, 1H), 4.82 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 6.99-7.26 (m, 5H), 7.61 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 7.69-7.74 (m, 2H); IR (KBr) 3426, 2936, 1728, 1591, 1494, 1468, 1330, 1289, 1232, 1149, 1091 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S·0.4H ₂ O) 計算値 (%): C, 60.37; H, 5.48; N, 6.40; F, 4.34; S, 7.33 実測値 (%): C, 60.53; H, 5.49; N, 6.26; F, 3.97; S, 6.93
Ic-30	mp 205-208 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.46-1.97 (m, 4H), 2.16-2.37 (m, 2H), 3.07 (m, 1H), 3.64-3.83 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 4.93 (s, 2H), 7.05 (m, 1H), 7.10-7.15 (m, 3H), 7.34 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 9.0 Hz, 2H).
Ic-31	mp 155-159 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.80 (m, 1H), 2.23 (m, 1H), 3.16 (dd, J = 8.7, 9.3 Hz, 1H), 3.34-3.56 (m, 3H), 3.74 (dd, J = 7.5, 9.9 Hz, 1H), 4.93 (s, 2H), 7.12 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.28 (dd, J = 3.6, 5.1 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 1.5, 3.6 Hz, 1H), 8.03 (dd, J = 1.5, 5.1 Hz, 1H), 12.99 (br, 1H); IR (Nujol) 2669, 1745, 1669, 1469, 1388, 1347, 1226, 1156, 1040 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₈ H ₁₇ ClN ₂ O ₄ S ₂) 計算値 (%): C, 50.88; H, 4.03; Cl, 8.34; N, 6.59; S, 15.09 実測値 (%): C, 55.86; H, 3.92; Cl, 8.04; N, 6.58; S, 15.00
Ic-32	mp 169-171 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.83 (m, 1H), 2.19 (m, 1H), 3.11 (dd, J = 8.7, 9.3 Hz, 1H), 3.29-3.50 (m, 3H), 3.71 (dd, J = 7.5, 9.9 Hz, 1H), 4.84 (s, 2H), 6.93 (dd, J = 1.5, 8.4 Hz, 1H), 7.00 (s, 1H), 7.13 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.19 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.42-7.50 (m, 2H), 7.89-7.96 (m, 2H), 12.89 (br, 1H); IR (Nujol) 2663, 1730, 1708, 1588, 1492, 1463, 1342, 1243, 1198, 1160, 1096, 1025 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₁ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 60.56; H, 5.08; F, 4.56; N, 6.73; S, 7.70 実測値 (%): C, 60.49; H, 5.08; F, 4.27; N, 6.67; S, 7.40

(表 4 5)

化合物 番号	物性値
lc-33	mp 145-149 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.83 (m, 1H), 2.20 (m, 1H), 2.36 (s, 3H), 3.16 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.34-3.54 (m, 3H), 3.74 (dd, J = 7.5, 9.6 Hz, 1H), 4.86 (s, 2H), 6.94 (dd, J = 1.5, 8.4 Hz, 1H), 7.01 (s, 1H), 7.17 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.20 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.30 (dd, J = 3.9, 5.1 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 1.5, 3.9 Hz, 1H), 8.05 (dd, J = 1.5, 5.1 Hz, 1H), 12.90 (br, 1H); IR (Nujol) 2662, 1705, 1484, 1463, 1348, 1246, 1156, 1034 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₉ H ₂₀ N ₂ O ₄ S ₂) 計算値 (%): C, 56.42; H, 4.98; N, 6.93; S, 15.85 実測値 (%): C, 56.33; H, 4.85; N, 6.84; S, 15.54
lc-34	mp 145-146 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.76 (m, 1H), 2.20 (m, 1H), 3.11 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.27-3.48 (m, 3H), 3.72 (dd, J = 7.5, 9.6 Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 7.10 (s, 1H), 7.11 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.61-7.66 (m, 2H), 7.73 (m, 1H), 7.83-7.87 (m, 2H), 12.98 (br, 1H); IR (Nujol) 2663, 1731, 1471, 1446, 1340, 1242, 1198, 1162, 1099, 1029 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₁₉ ClN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 57.34; H, 4.57; Cl, 8.46; N, 6.69; S, 7.65 実測値 (%): C, 57.00; H, 4.48; Cl, 8.13; N, 6.71; S, 7.43
lc-35	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.97 (m, 1H), 2.30 (m, 1H), 3.08 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.29-3.59 (m, 3H), 3.68 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.50 (d, J = 13.5 Hz, 1H), 4.56 (d, J = 13.5 Hz, 1H), 4.98 (s, 2H), 7.14 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.29 (s, 1H), 7.36-7.50 (m, 6H), 7.59 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 13.01 (br, 1H); IR (KBr) 3439, 2637, 1731, 1471, 1329, 1152 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₁ ClN ₂ O ₄ S·0.6H ₂ O) 計算値 (%): C, 56.84; H, 5.04; Cl, 7.99; N, 6.31; S, 7.23 実測値 (%): C, 56.96; H, 4.81; Cl, 7.61; N, 6.34; S, 7.17
lc-36	mp 158-159 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.82 (m, 1H), 2.22 (m, 1H), 3.13 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.28-3.50 (m, 3H), 3.72 (dd, J = 7.5, 9.3 Hz, 1H), 4.91 (s, 2H), 7.13 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.37 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.64-7.68 (m, 2H), 7.82-7.86 (m, 2H), 12.99 (br, 1H); IR (Nujol) 2669, 1741, 1726, 1472, 1346, 1246, 1162, 1100, 1086, 1032 cm ⁻¹ .
lc-37	mp 195-196 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.76 (m, 1H), 2.19 (m, 1H), 2.42 (s, 3H), 3.08 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.26-3.45 (m, 3H), 3.68 (dd, J = 7.5, 9.3 Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 7.10 (s, 1H), 7.11 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.42-7.44 (m, 4H), 7.71-7.74 (m, 2H), 12.98 (br, 1H); IR (Nujol) 2671, 1728, 1470, 1347, 1249, 1199, 1158, 1097, 1030 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₁ ClN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 58.26; H, 4.89; Cl, 8.19; N, 6.47; S, 7.41 実測値 (%): C, 58.18; H, 4.87; Cl, 7.92; N, 6.40; S, 7.28

(表 4 6)

化合物 番号	物性値
lc-38	mp 166-168 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.81 (m, 1H), 2.20 (m, 1H), 3.10 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.27-3.50 (m, 3H), 3.72 (dd, J = 7.5, 9.3 Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 6.95 (m, 1H), 7.15-7.19 (m, 2H), 7.34 (dd, J = 4.5, 9.0 Hz, 1H), 7.40-7.47 (m, 2H), 7.85-7.94 (m, 2H), 12.96 (br, 1H); IR (Nujol) 2662, 1725, 1715, 1587, 1457, 1341, 1333, 1237, 1198, 1160, 1096 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₁₈ F ₂ N ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 57.14; H, 4.32; F, 9.04; N, 6.66; S, 7.63 実測値 (%): C, 57.15; H, 4.25; F, 8.79; N, 6.54; S, 7.57
lc-39	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.80 (m, 1H), 2.22 (m, 1H), 3.15 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.31-3.53 (m, 3H), 3.75 (dd, J = 7.5, 9.6 Hz, 1H), 4.92 (s, 2H), 6.96 (m, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.21 (dd, J = 2.4, 9.9 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 3.9, 4.8 Hz, 1H), 7.35 (dd, J = 4.5, 9.0 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 1.2, 3.9 Hz, 1H), 8.03 (dd, J = 1.2, 4.8 Hz, 1H), 12.97 (br, 1H); IR (KBr) 1729, 1626, 1580, 1486, 1457, 1403, 1344, 1225, 1155 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₈ H ₁₇ FN ₂ O ₄ S ₂) 計算値 (%): C, 52.24; H, 4.29; F, 4.59; N, 6.77; S, 15.50 実測値 (%): C, 52.26; H, 4.22; F, 4.46; N, 6.33; S, 15.47
lc-40	mp 157-160 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.82 (m, 1H), 2.21 (m, 1H), 3.10 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.30-3.50 (m, 3H), 3.71 (dd, J = 7.5, 9.6 Hz, 1H), 3.74 (s, 3H), 4.83 (s, 2H), 6.75 (dd, J = 2.4, 8.7 Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.00 (s, 1H), 7.21 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.40-7.48 (m, 2H), 7.88-7.95 (m, 2H), 12.90 (br, 1H); IR (Nujol) 3204, 1742, 1718, 1622, 1586, 1493, 1452, 1338, 1331, 1224, 1151, 1095, 1037, 1027 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₁ FN ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 58.32; H, 4.89; F, 4.39; N, 6.48; S, 7.41 実測値 (%): C, 58.02; H, 5.07; F, 4.22; N, 6.30; S, 7.15
lc-41	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.82 (m, 1H), 2.23 (m, 1H), 3.14 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.30-3.52 (m, 3H), 3.75 (m, 1H), 3.75 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.76 (dd, J = 2.4, 8.7 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.01 (s, 1H), 7.22 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.29 (dd, J = 3.9, 5.1 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 1.2, 3.6 Hz, 1H), 8.04 (dd, J = 1.2, 5.1 Hz, 1H), 12.74 (br, 1H); IR (KBr) 1727, 1622, 1580, 1488, 1454, 1403, 1345, 1226, 1155, 1031 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₉ H ₂₀ N ₂ O ₅ S ₂ ·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 53.81; H, 4.85; N, 6.61; S, 15.12 実測値 (%): C, 53.85; H, 4.87; N, 6.34; S, 15.01
lc-42	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.82 (m, 1H), 2.16 (m, 1H), 3.09 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.25-3.47 (m, 3H), 3.69 (dd, J = 7.5, 9.9 Hz, 1H), 4.79 (s, 2H), 6.63 (dd, J = 2.1, 9.0 Hz, 1H), 6.72 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.10 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.42-7.47 (m, 2H), 7.88-7.93 (m, 2H), (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.61-7.66 (m, 2H), 7.73 (m, 1H), 8.73 (br, 1H), 12.87 (br, 1H); IR (KBr) 3436, 1730, 1625, 1590, 1492, 1466, 1332, 1293, 1226, 1153, 1096 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₁₉ FN ₂ O ₅ S·0.7H ₂ O) 計算値 (%): C, 55.73; H, 4.77; F, 4.41; N, 6.50; S, 7.44 実測値 (%): C, 55.69; H, 4.68; F, 4.05; N, 6.28; S, 7.19

(表 4 7)

化合物 番号	物性値
lc-43	mp 119-123 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.90 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.34-1.46 (m, 2H), 1.60-1.79 (m, 2H), 2.03 (m, 1H), 2.36 (m, 1H), 3.02-3.65 (m, 6H), 3.80 (dd, J = 7.5, 9.0 Hz, 1H), 4.96 (s, 2H), 6.98 (m, 1H), 7.33-7.44 (m, 3H), 12.96 (br, 1H); IR (Nujol) 3254, 1751, 1626, 1583, 1488, 1456, 1318, 1299, 1274, 1183, 1127, 1095, 1045 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₈ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 56.53; H, 6.06; F, 4.97; N, 7.32; S, 8.38 実測値 (%): C, 56.46; H, 5.99; F, 4.76; N, 7.19; S, 8.20
lc-44	mp 178-182 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.99 (m, 1H), 2.33 (m, 1H), 3.20 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.23-3.60 (m, 3H), 3.80 (dd, J = 7.5, 9.9 Hz, 1H), 4.91 (s, 2H), 6.95 (m, 1H), 7.29 (s, 1H), 7.31-7.47 (m, 7H), 7.73-7.76 (m, 2H), 12.95 (br, 1H); IR (Nujol) 1719, 1620, 1577, 1486, 1459, 1331, 1228, 1144, 1048, 1023 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₁ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 61.67; H, 4.94; F, 4.43; N, 6.54; S, 7.48 実測値 (%): C, 61.45; H, 4.92; F, 4.27; N, 6.40; S, 7.40
lc-45	mp 205-207 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.82 (m, 1H), 2.22 (m, 1H), 3.15 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.34-3.54 (m, 3H), 3.76 (dd, J = 7.5, 9.3 Hz, 1H), 4.88 (s, 2H), 6.95 (m, 1H), 7.17 (s, 1H), 7.20 (dd, J = 2.4, 9.9 Hz, 1H), 7.32 (dd, J = 4.5, 9.0 Hz, 1H), 7.43-7.56 (m, 3H), 7.76-7.79 (m, 2H), 9.93 (s, 4H), 12.93 (br, 1H); IR (Nujol) 1721, 1597, 1483, 1457, 1337, 1233, 1199, 1158 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₆ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 65.26; H, 4.84; F, 3.97; N, 5.85; S, 6.70 実測値 (%): C, 65.03; H, 4.85; F, 3.78; N, 5.72; S, 6.59
lc-46	mp 172-174 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 2.20 (m, 1H), 2.36 (m, 1H), 2.94 (s, 3H), 3.16 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.33-3.64 (m, 3H), 3.79 (dd, J = 7.2, 9.0 Hz, 1H), 4.97 (s, 2H), 6.98 (m, 1H), 7.34 (s, 1H), 7.38 (dd, J = 4.2, 9.0 Hz, 1H), 7.44 (dd, J = 2.4, 10.2 Hz, 1H), 12.98 (br, 1H); IR (Nujol) 1722, 1487, 1456, 1318, 1233, 1196, 1141, 1042 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₅ H ₁₇ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 52.93; H, 5.03; F, 5.58; N, 8.23; S, 9.42 実測値 (%): C, 52.76; H, 4.96; F, 5.39; N, 8.15; S, 9.20
lc-47	mp 171-173 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.88 (m, 1H), 2.26 (m, 1H), 3.17 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.34-3.57 (m, 3H), 3.76 (dd, J = 6.9, 9.3 Hz, 1H), 4.93 (s, 2H), 7.12 (s, 1H), 7.32 (m, 1H), 7.39-7.48 (m, 6H), 7.63-7.68 (m, 3H), 7.89-7.96 (m, 2H), 12.99 (br, 1H); IR (Nujol) 2668, 1736, 1592, 1493, 1476, 1347, 1335, 1258, 1244, 1187, 1166, 1154 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₆ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 65.26; H, 4.84; F, 3.97; N, 5.85; S, 6.70 実測値 (%): C, 65.29; H, 4.84; F, 3.91; N, 5.75; S, 6.78
lc-48	mp 161-163 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.89 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.34-1.46 (m, 2H), 1.61-1.71 (m, 2H), 2.08 (m, 1H), 2.41 (m, 1H), 3.04-3.20 (m, 2H), 3.27-3.58 (m, 3H), 3.68-3.86 (m, 2H), 4.99 (s, 2H), 7.29-7.33 (m, 2H), 7.42-7.48 (m, 4H), 7.68-7.71 (m, 2H), 7.86 (s, 1H), 12.97 (br, 1H); IR (Nujol) 2666, 1715, 1478, 1455, 1325, 1243, 1197, 1133, 1094, 1046 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₈ N ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 65.43; H, 6.41; N, 6.36; S, 7.28 実測値 (%): C, 65.16; H, 6.37; N, 6.24; S, 7.29

(表 4 8)

化合物 番号	物性値
lc-49	mp 174-178 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.86 (m, 1H), 2.28 (m, 1H), 3.18-3.57 (m, 4H), 3.78 (dd, J = 6.9, 9.3 Hz, 1H), 4.94 (s, 2H), 7.12 (s, 1H), 7.27 (dd, J = 3.9, 5.1 Hz, 1H), 7.32 (m, 1H), 7.42-7.49 (m, 4H), 7.64-7.70 (m, 3H), 7.75 (dd, J = 1.5, 3.9 Hz, 1H), 8.02 (dd, J = 1.5, 5.1 Hz, 1H), 12.97 (br, 1H); IR (Nujol) 2664, 1738, 1714, 1476, 1345, 1336, 1251, 1187, 1157, 1020 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₂ N ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 61.78; H, 4.75; N, 6.00; S, 13.74 実測値 (%): C, 61.73; H, 4.74; N, 5.90; S, 13.62
lc-50	mp 160-170 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.99 (m, 1H), 2.32 (m, 1H), 3.00 (t, J 8.1 Hz, 1H), 3.17 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.35-3.61 (m, 5H), 3.83 (dd, J = 7.5, 9.0 Hz, 1H), 4.93 (s, 2H), 6.97 (m, 1H), 7.20-7.43 (m, 8H), 12.94 (br, 1H); IR (Nujol) 3617, 3498, 2625, 1739, 1713, 1488, 1458, 1327, 1224, 1147, 1135, 1049 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S·H ₂ O) 計算値 (%): C, 58.91; H, 5.62; F, 4.24; N, 6.25; S, 7.15 実測値 (%): C, 59.09; H, 5.51; F, 4.17; N, 6.12; S, 7.19
lc-51	mp 192-194 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.82 (m, 1H), 2.21 (m, 1H), 3.11 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.27-3.50 (m, 3H), 3.73 (dd, J = 7.5, 9.3 Hz, 1H), 4.89 (d, J = 18.3 Hz, 1H), 4.95 (d, J = 18.3 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 1.5, 8.4 Hz, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.40-7.51 (m, 4H), 7.87-7.93 (m, 2H), 12.97 (br, 1H); IR (Nujol) 2641, 1736, 1529, 1492, 1470, 1414, 1335, 1241, 1227, 1178, 1168, 1159 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₁₈ ClFN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 54.98; H, 4.15; Cl, 8.11; F, 4.35; N, 6.41; S, 7.34 実測値 (%): C, 54.95; H, 4.07; Cl, 7.91; F, 4.33; N, 6.40; S, 7.36
lc-52	Mp 224-226 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.81 (m, 1H), 2.22 (m, 1H), 3.15 (dd, J = 8.7, 9.6 Hz, 1H), 3.34-3.53 (m, 3H), 3.75 (dd, J = 7.2, 9.6 Hz, 1H), 4.90 (d, J = 18.3 Hz, 1H), 4.96 (d, J = 18.3 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 1.8, 8.4 Hz, 1H), 7.12 (s, 1H), 7.29 (dd, J = 3.9, 5.1 Hz, 1H), 7.41 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.51 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 1.5, 3.9 Hz, 1H), 8.04 (dd, J = 1.5, 5.1 Hz, 1H), 12.97 (br, 1H); IR (Nujol) 1729, 1472, 1341, 1327, 1236, 1200, 1157, 1032 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₈ H ₁₇ ClN ₂ O ₄ S ₂ ·AcOEt) 計算値 (%): C, 51.09; H, 4.33; Cl, 7.85; N, 6.21; S, 14.21 実測値 (%): C, 50.97; H, 4.22; Cl, 7.65; N, 6.31; S, 14.51
lc-53	Mp 133-136 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.93 (m, 1H), 2.30 (m, 1H), 3.19-3.59 (m, 4H), 3.80 (m, 1H), 4.89 (d, J = 18.9 Hz, 1H), 4.95 (d, J = 18.9 Hz, 1H), 7.12 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.19 (s, 1H), 7.36-7.50 (m, 3H), 7.53 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.69-7.88 (m, 2H), 12.99 (brs, 1H); IR (Nujol) 3093, 2668, 2575, 1714, 1598, 1472, 1416, 1376, 1351, 1304, 1263, 1248, 1223, 1189, 1164, 1127, 1108 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₁₈ ClFN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 54.98; H, 4.15; Cl, 8.11; F, 4.35; N, 6.41; S, 7.34 実測値 (%): C, 54.68; H, 4.01; Cl, 7.81; F, 4.17; N, 6.38; S, 7.30

(表 4 9)

化合物 番号	物性値
lc-54	mp 162-165 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.82 (m, 1H), 2.20 (m, 1H), 3.11-3.52 (m, 4H), 3.75 (dd, J = 7.2, 9.6 Hz, 1H), 4.92 (d, J = 18.6 Hz, 1H), 4.94 (d, J = 18.6 Hz, 1H), 7.11 (dd, J = 2.1, 8.4 Hz, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.37 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.53-7.73 (m, 4H), 12.99 (brs, 1H); IR (Nujol) 3084, 2667, 2573, 1710, 1590, 1472, 1415, 1390, 1378, 1345, 1304, 1267, 1249, 1221, 1197, 1162, 1106 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₁₈ ClFN ₂ O ₄ S·0.1AcOEt) 計算値 (%): C, 54.97; H, 4.25; Cl, 7.95; F, 4.26; N, 6.29; S, 7.19 実測値 (%): C, 54.97; H, 4.11; Cl, 7.74; F, 4.36; N, 6.36; S, 7.25
lc-55	mp 193-197 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.94-2.02 (m, 2H), 2.21 (s, 3H), 3.15-3.69 (m, 5H), 4.92 (s, 2H), 6.88 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 1.5, 8.7 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.50-7.57 (m, 2H), 7.96-8.01 (m, 2H), 13.04 (br, 1H); IR (Nujol) 1734, 1592, 1494, 1469, 1338, 1169, 1159 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₀ ClFN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 55.94; H, 4.47; Cl, 7.86; F, 4.21; N, 6.21; S, 7.11 実測値 (%): C, 55.78; H, 4.41; Cl, 7.59; F, 4.28; N, 6.25; S, 7.10
lc-56	mp 196-201 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.98-2.07 (m, 2H), 2.21 (s, 3H), 3.24-3.40 (m, 2H), 3.45-3.55 (m, 2H), 3.65 (m, 1H), 4.93 (s, 2H), 7.02-7.05 (m, 2H), 7.36-7.40 (m, 2H), 7.81 (dd, J = 1.5, 3.6 Hz, 1H), 8.13 (dd, J = 1.5, 5.1 Hz, 1H), 13.06 (br, 1H); IR (Nujol) 3278, 1770, 1739, 1470, 1346, 1325, 1231, 1221, 1159, 1089, 1059, 1027 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₉ H ₁₉ ClN ₂ O ₄ S ₂) 計算値 (%): C, 51.99; H, 4.36; Cl, 8.08; N, 6.38; S, 14.61 実測値 (%): C, 51.86; H, 4.34; Cl, 7.75; N, 6.36; S, 14.74
lc-57	mp 153-161 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.94 (t, J = 7.8 Hz, 3H), 1.39-1.52 (m, 2H), 1.67-1.77 (m, 2H), 2.13 (m, 1H), 2.31 (m, 1H), 2.31 (s, 3H), 3.20 (m, 1H), 3.33-3.43 (m, 3H), 3.54-3.76 (m, 3H), 4.96 (s, 2H), 7.07 (dd, J = 2.1, 9.0 Hz, 1H), 7.41 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 13.06 (br, 1H); IR (Nujol) 3187, 1759, 1713, 1472, 1420, 1380, 1328, 1318, 1301, 1247, 1190, 1142, 1114, 1049 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₉ H ₂₅ ClN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 55.26; H, 6.10; Cl, 8.59; N, 6.78; S, 7.77 実測値 (%): C, 55.47; H, 6.10; Cl, 8.36; N, 6.77; S, 7.54
lc-58	mp 180-183 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.85 (m, 1H), 2.24 (m, 1H), 3.13-3.55 (m, 4H), 3.77 (dd, J = 7.5, 9.6 Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 7.11 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.19 (s, 1H), 7.37 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 8.06 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 12.95 (brs, 1H); IR (Nujol) 3092, 2730, 2665, 2553, 1723, 1695, 1612, 1473, 1403, 1378, 1329, 1289, 1268, 1245, 1233, 1189, 1163, 1140, 1106 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₁₈ ClF ₃ N ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 51.80; H, 3.73; Cl, 7.28; F, 11.71; N, 5.75; S, 6.59 実測値 (%): C, 51.65; H, 3.66; Cl, 7.02; F, 11.55; N, 5.76; S, 6.72

(表 50)

化合物 番号	物性値
lc-59	mp 136-142 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.90 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.34-1.47 (m, 2H), 1.59-1.72 (m, 2H), 2.02 (m, 1H), 2.36 (m, 1H), 3.03-3.68 (m, 6H), 3.80 (dd, J = 7.5, 9.0 Hz, 1H), 4.97 (s, 2H), 7.13 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.34 (s, 1H), 7.41 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 13.00 (brs, 1H); IR (Nujol) 3133, 3093, 2664, 2549, 1721, 1697, 1472, 1403, 1389, 1333, 1297, 1277, 1242, 1231, 1199, 1146, 1100 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₈ H ₂₃ ClN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 54.20; H, 5.81; Cl, 8.89; N, 7.02; S, 8.04 実測値 (%): C, 54.09; H, 5.74; Cl, 8.65; N, 7.00; S, 7.93
lc-60	mp 158-162 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.81-0.91 (m, 3H), 1.17-1.46 (m, 10H), 1.58-1.74 (m, 2H), 2.02 (m, 1H), 2.35 (m, 1H), 3.01-3.68 (m, 6H), 3.80 (dd, J = 7.5, 9.0 Hz, 1H), 4.97 (s, 2H), 7.13 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.34 (s, 1H), 7.41 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 13.00 (brs, 1H); IR (Nujol) 3135, 3094, 1720, 1695, 1471, 1403, 1391, 1378, 1333, 1285, 1230, 1199, 1146, 1119 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₃₁ ClN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 58.07; H, 6.87; Cl, 7.79; N, 6.16; S, 7.05 実測値 (%): C, 58.00; H, 6.82; Cl, 7.55; N, 6.20; S, 6.99
lc-61	mp 220-223 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.92 (m, 1H), 2.29 (m, 1H), 3.15-3.60 (m, 4H), 3.83 (dd, J = 7.5, 9.3 Hz, 1H), 4.86 (s, 2H), 7.09 (s, 1H), 7.10 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.35 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.63-7.77 (m, 3H), 8.11 (m, 1H), 8.16 (m, 1H), 8.27 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.75 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 12.96 (brs, 1H); IR (Nujol) 3266, 3064, 3045, 1764, 1736, 1592, 1565, 1506, 1471, 1430, 1404, 1385, 1345, 1329, 1266, 1203, 1187, 1161, 1137, 1111 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₁ ClN ₂ O ₄ S·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 61.00; H, 4.56; Cl, 7.50; N, 5.93; S, 6.79 実測値 (%): C, 61.11; H, 4.57; Cl, 7.33; N, 5.93; S, 6.63
lc-62	mp 195-198 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.88 (m, 1H), 2.24 (m, 1H), 3.13-3.59 (m, 4H), 3.77 (dd, J = 7.2, 9.3 Hz, 1H), 4.89 (s, 2H), 7.09 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.18 (s, 1H), 7.34 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 8.35 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 12.97 (brs, 1H); IR (Nujol) 3108, 3068, 1738, 1606, 1530, 1472, 1414, 1401, 1376, 1348, 1320, 1303, 1261, 1238, 1227, 1200, 1179, 1165, 1134, 1103 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₁₈ ClN ₃ O ₆ S) 計算値 (%): C, 51.78; H, 3.91; Cl, 7.64; N, 9.06; S, 6.91 実測値 (%): C, 51.59; H, 3.81; Cl, 7.34; N, 8.87; S, 6.84
lc-63	¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.83 (m, 1H), 2.22 (m, 1H), 3.12-3.83 (m, 5H), 4.83, 4.87 (each s, total 2H), 7.06-7.19 (m, 2H), 7.31-7.43 (m, 2H), 7.89-8.16 (m, 4H); IR (KBr) 3413, 3226, 3091, 2233, 1728, 1611, 1568, 1472, 1437, 1399, 1344, 1282, 1218, 1161, 1107 cm ⁻¹ .

(表 5 1)

化合物 番号	物性値
lc-64	Mp 205-206 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.92 (m, 1H), 2.19 (m, 1H), 3.10 (m, 1H), 3.34-3.51 (m, 2H), 3.69-3.79 (m, 2H), 4.90 (d, J = 18.3 Hz, 1H), 4.96 (d, J = 18.3 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 1.2, 7.8 Hz, 1H), 7.09 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.23 (s, 1H), 7.33 (dd, J = 1.2, 7.8 Hz, 1H), 7.39-7.45 (m, 2H), 7.85-7.91 (m, 2H), 13.03 (br, 1H); IR (Nujol) 2662, 1723, 1589, 1491, 1476, 1447, 1350, 1332, 1248, 1236, 1182, 1162, 1098, 1029 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₁₈ ClFN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 54.98; H, 4.15; Cl, 8.11; F, 4.35; N, 6.41; S, 7.34 実測値 (%): C, 55.04; H, 4.13; Cl, 7.79; F, 4.33; N, 6.42; S, 7.32
lc-65	mp 170-171 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.93 (m, 1H), 2.21 (m, 1H), 3.14 (m, 1H), 3.37-3.54 (m, 2H), 3.72-3.83 (m, 2H), 4.91 (d, J = 18.6 Hz, 1H), 4.98 (d, J = 18.6 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 1.2, 7.8 Hz, 1H), 7.09 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.26 (dd, J = 3.9, 5.1 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 1.2, 8.1 Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 1.5, 3.9 Hz, 1H), 8.01 (dd, J = 1.5, 5.1 Hz, 1H), 13.02 (br, 1H); IR (Nujol) 3204, 1755, 1728, 1554, 1453, 1401, 1338, 1326, 1196, 1146, 1033 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₈ H ₁₇ ClN ₂ O ₄ S ₂) 計算値 (%): C, 50.88; H, 4.03; Cl, 8.34; N, 6.59; S, 15.09 実測値 (%): C, 50.87; H, 3.97; Cl, 8.10; N, 6.52; S, 14.89
lc-66	mp 169-171 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.88 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.32-1.45 (m, 2H), 1.59-1.69 (m, 2H), 2.08 (m, 1H), 2.35 (m, 1H), 2.99-3.14 (m, 2H), 3.21 (dd, J = 8.4, 9.3 Hz, 1H), 3.38-3.54 (m, 2H), 3.88 (dd, J = 6.9, 9.6 Hz, 1H), 4.04 (m, 2H), 5.00 (s, 2H), 7.06-7.14 (m, 2H), 7.37 (dd, J = 1.2, 7.5 Hz, 1H), 7.44 (s, 1H), 13.06 (br, 1H); IR (Nujol) 2660, 1715, 1555, 1480, 1451, 1404, 1327, 1246, 1182, 1140, 1096, 1041 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₈ H ₂₃ ClN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 54.20; H, 5.81; Cl, 8.89; N, 7.02; S, 8.04 実測値 (%): C, 54.05; H, 5.76; Cl, 8.72; N, 7.00; S, 8.03
lc-67	mp 170-173 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.81 (m, 1H), 2.23 (m, 1H), 3.11-3.49 (m, 4H), 3.70 (dd, J = 7.2, 9.6 Hz, 1H), 4.23 (s, 2H), 4.94 (s, 2H), 7.06 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 7.13 (dd, 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.18 (s, 1H), 7.21-7.36 (m, 5H), 7.40 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 13.00 (brs, 1H); IR (Nujol) 3084, 3027, 2665, 2570, 1731, 1601, 1571, 1554, 1527, 1494, 1472, 1442, 1415, 1380, 1344, 1244, 1198, 1156, 1113 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₅ H ₂₃ ClN ₂ O ₄ S ₂) 計算値 (%): C, 58.30; H, 4.50; Cl, 6.88; N, 5.44; S, 12.45 実測値 (%): C, 58.15; H, 4.39; Cl, 6.64; N, 5.39; S, 12.35

(表 5 2)

化合物 番号	物性値
lc-68	mp 207-210°C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.85 (m, 1H), 2.20 (m, 1H), 3.17-3.57 (m, 3H), 3.88 (m, 1H), 4.13 (m, 1H), 4.88 (s, 2H), 7.09 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.31 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 4.2, 8.1 Hz, 1H), 7.76 (dd, J = 7.5, 8.1 Hz, 1H), 8.31 (dd, J = 1.5, 8.1 Hz, 1H), 8.42 (dd, J = 1.5, 7.5 Hz, 1H), 8.56 (dd, J = 1.5, 8.1 Hz, 1H), 9.05 (dd, J = 1.5, 4.2 Hz, 1H), 12.94 (brs, 1H); IR (Nujol) 3539, 3214, 3032, 2725, 2614, 1768, 1747, 1726, 1611, 1596, 1561, 1493, 1470, 1419, 1378, 1362, 1338, 1265, 1223, 1211, 1198, 1159, 1140, 1131, 1101 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₃ H ₂₀ ClN ₃ O ₄ S·0.5H ₂ O) 計算値 (%): C, 57.68; H, 4.42; Cl, 7.40; N, 8.77; S, 6.69 実測値 (%): C, 57.77; H, 4.32; Cl, 7.18; N, 8.76; S, 6.70
lc-69	mp 166-170 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.80 (m, 1H), 2.22 (m, 1H), 3.09-3.51 (m, 4H), 3.73 (dd, J = 7.2, 9.3 Hz, 1H), 4.93 (s, 2H), 7.12 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.46 (dd, J = 1.2, 5.1 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.82 (dd, J = 3.0, 5.1 Hz, 1H), 8.33 (dd, J = 1.2, 3.0 Hz, 1H), 12.95 (brs, 1H); IR (Nujol) 3112, 3087, 2669, 1743, 1710, 1667, 1469, 1431, 1387, 1363, 1342, 1303, 1247, 1220, 1202, 1155, 1106 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₈ H ₁₇ ClN ₂ O ₄ S ₂) 計算値 (%): C, 50.88; H, 4.03; Cl, 8.34; N, 6.59; S, 15.09 実測値 (%): C, 50.76; H, 3.92; Cl, 8.14; N, 6.53; S, 15.08
lc-70	mp 222-226°C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.85 (m, 1H), 2.22 (m, 1H), 3.13-3.60 (m, 4H), 3.82 (dd, J = 7.2, 9.3 Hz, 1H), 4.85 (s, 2H), 7.06 (s, 1H), 7.09 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.47-7.58 (m, 2H), 8.15 (m, 1H), 8.27 (m, 1H), 8.63 (s, 1H), 12.86 (brs, 1H); IR (Nujol) 3275, 3079, 1764, 1734, 1485, 1471, 1454, 1421, 1405, 1386, 1342, 1320, 1304, 1260, 1241, 1221, 1186, 1159, 1158, 1147, 1114 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₁₉ ClN ₂ O ₄ S ₂) 計算値 (%): C, 55.63; H, 4.03; Cl, 7.46; N, 5.90; S, 13.50 実測値 (%): C, 55.46; H, 4.12; Cl, 7.17; N, 5.76; S, 13.27
lc-71	mp 166.5-168°C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.95 (m, 1H), 2.30 (m, 1H), 3.10-3.61 (m, 4H), 3.78 (m, 1H), 4.93 (s, 2H), 7.12 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.19-7.32 (m, 2H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.48-7.59 (m, 2H), 7.90 (m, 1H), 13.00 (brs, 1H); IR (Nujol) 3092, 3056, 2731, 2658, 2550, 1722, 1696, 1604, 1473, 1426, 1403, 1384, 1340, 1272, 1233, 1206, 1196, 1163, 1120, 1103 cm ⁻¹ .
lc-72	Mp 223-225°C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.99 (m, 1H), 2.37 (m, 1H), 2.94 (s, 3H), 3.16 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.25-3.68 (m, 3H), 3.80 (dd, J = 7.5, 9.0 Hz, 1H), 4.98 (s, 2H), 7.13 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.34 (s, 1H), 7.40 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.70 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 13.00 (br, 1H); IR (Nujol) 3275, 1764, 1744, 1473, 1426, 1398, 1384, 1381, 1361, 1338, 1305, 1253, 1222, 1202, 1175, 1150 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₅ H ₁₇ ClN ₂ O ₄ S·0.2AcOEt) 計算値 (%): C, 50.68; H, 5.01; Cl, 9.47; N, 7.48; S, 8.56 実測値 (%): C, 50.48; H, 4.83; Cl, 9.49; N, 7.68; S, 8.52

(表 5 3)

化合物 番号	物性値
lc-73	mp 196-198°C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.76 (m, 1H), 2.19 (m, 1H), 3.07 (m, 1H), 3.15-3.48 (m, 3H), 3.67 (dd, $J = 7.5, 9.3$ Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 4.90 (s, 2H), 7.08-7.16 (m, 2H), 7.13 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.37 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.44 (d, $J = 1.8$, 1H), 7.77 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 12.98 (br, 1H); IR (Nujol) 3083, 3050, 2667, 2572, 1728, 1593, 1574, 1497, 1473, 1444, 1415, 1381, 1340, 1307, 1258, 1245, 1194, 1157, 1110 cm^{-1} .
lc-74	mp 195-199°C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.98(m, 1H), 2.33 (m, 1H), 2.94 (s, 3H), 3.16 (t, $J = 9.0$ Hz, 1H), 3.25-3.68 (m, 3H), 3.80 (dd, $J = 7.5, 9.0$ Hz, 1H), 4.98 (s, 2H), 7.13 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 7.34 (s, 1H), 7.40 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.70 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 13.00 (brs, 1H); IR (Nujol) 3054, 3028, 2645, 2541, 1716, 1616, 1576, 1494, 1470, 1448, 1408, 1381, 1336, 1301, 1261, 1228, 1192, 1146, 1111 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{22}\text{ClN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.2\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 59.20; H, 4.92; Cl, 7.66; N, 6.06; S, 6.93 実測値 (%): C, 59.32; H, 4.76; Cl, 7.41; N, 6.19; S, 6.94
lc-75	mp 190-193°C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.83 (m, 1H), 2.24 (m, 1H), 3.16 (m, 1H), 3.24-3.57 (m, 3H), 3.78 (dd, $J = 7.2, 9.6$ Hz, 1H), 4.88 (d, $J = 18.2$ Hz, 1H), 4.94 (d, $J = 18.2$ Hz, 1H), 7.11 (dd, $J = 1.8, 8.7$ Hz, 1H), 7.18 (s, 1H), 7.37 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.51 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.63 (m, 1H), 8.24 (m, 1H), 8.87 (dd, $J = 1.8, 4.8$ Hz, 1H), 9.00 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 12.99 (brs, 1H); IR (Nujol) 3124, 3083, 3056, 2726, 2594, 2516, 1928, 1843, 1778, 1732, 1612, 1589, 1567, 1553, 1473, 1416, 1357, 1335, 1325, 1273, 1254, 1232, 1210, 1191, 1173, 1166, 1116 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{ClN}_3\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 54.35; H, 4.32; Cl, 8.44; N, 10.01; S, 7.64 実測値 (%): C, 54.29; H, 4.31; Cl, 8.20; N, 9.95; S, 7.43
lc-76	mp 105-107 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.94-2.20 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 3.30-3.60 (m, 4H), 3.66 (m, 1H), 4.88 (s, 2H), 6.80-7.08 (m, 3H), 7.34 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.38 (dd, $J = 3.6, 4.8$ Hz, 1H), 7.80 (dd, $J = 1.2, 3.6$ Hz, 1H), 8.14 (dd, $J = 1.2, 5.1$ Hz, 1H); IR (Nujol) 2924, 1748, 1693, 1611, 1467, 1376, 1335, 1292, 1156 cm^{-1} .
lc-77	mp 125-126 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.07 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 2H), 1.64 (m, 2H), 2.13 (m, 1H), 2.31 (m, 1H), 2.31 (s, 3H), 3.13-3.28 (m, 2H), 3.22-3.80 (m, 5H), 4.92 (s, 2H), 6.94 (m, 2H), 7.35 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.55 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H); IR (Nujol) 3243, 3053, 2924, 1755, 1567, 1418, 1321, 1298, 1275, 1180, 1143 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{26}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 60.29; H, 6.92; N, 7.40; S, 8.47 実測値 (%): C, 59.80; H, 6.86; N, 7.29; S, 8.51

(表 5 4)

化合物 番号	物性値
lc-78	mp 140-142°C; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ 1.84 (m, 1H), 2.28 (m, 1H), 3.15-3.57 (m, 4H), 3.75 (m, 1H), 4.93 (s, 2H), 7.13 (dd, $J = 1.8$, 8.7 Hz, 1H), 7.22 (s, 1H), 7.33 (d, $J = 4.2$ Hz, 1H), 7.39 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.62 (d, $J = 4.2$ Hz, 1H), 12.90 (brs, 1H); IR (Nujol) 3091, 2670, 2577, 1726, 1567, 1513, 1471, 1445, 1414, 1380, 1357, 1332, 1310, 1266, 1249, 1199, 1180, 1155, 1112 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{18}\text{H}_{16}\text{Cl}_2\text{N}_2\text{O}_4\text{S}_2 \cdot 0.05\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 47.13; H, 3.56; Cl, 15.29; N, 6.04; S, 13.83 実測値 (%): C, 46.95; H, 3.47; Cl, 15.10; N, 6.11; S, 14.02
lc-79	mp 220-221 °C; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ 1.76 (m, 1H), 2.19 (m, 1H), 3.06 (t, $J = 9.3$ Hz, 1H), 3.22-3.46 (m, 3H), 3.65 (dd, $J = 7.5$, 9.3 Hz, 1H), 4.91 (s, 2H), 6.92-6.96 (m, 2H), 7.11 (dd, $J = 2.1$, 8.4 Hz, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.37 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.47 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.64-7.69 (m, 2H), 10.48 (br, 1H), 12.97 (br, 1H); IR (Nujol) 3409, 1741, 1712, 1603, 1586, 1500, 1472, 1440, 1319, 1245, 1151, 1094, 1028 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{20}\text{H}_{19}\text{ClN}_2\text{O}_5\text{S}$) 計算値 (%): C, 55.24; H, 4.40; Cl, 8.15; N, 6.44; S, 7.37 実測値 (%): C, 55.21; H, 4.52; Cl, 7.62; N, 6.20; S, 7.14
lc-80	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.84-1.89 (m, 2H), 2.04-2.17 (m, 3H), 3.49-3.54 (m, 3H), 4.88 (m, 1H), 5.12 (m, 1H), 7.09-7.45 (m, 5H), 7.85-8.08 (m, 3H), 8.30 (m, 1H); IR (KBr) 3387, 1739, 1647, 1591, 1526, 1493, 1467, 1428, 1389, 1343, 1292, 1236, 1152, 1092, 1066, 1011 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 1.0\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 56.24; H, 4.72; N, 6.25; F, 4.24; S, 7.15 実測値 (%): C, 56.18; H, 4.56; N, 6.29; F, 4.11, S, 7.06
lc-81	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.43-1.68 (m, 4H), 2.88 (m, 1H), 3.09 (m, 1H), 3.34-3.44 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.91 (m, 1H), 4.85 (s, 2H), 6.93-6.98 (m, 3H), 7.20-7.26 (m, 3H), 7.80-7.83 (m, 3H); IR (KBr) 2945, 1728, 1596, 1497, 1468, 1331, 1260, 1153, 1092, 1024 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{24}\text{N}_2\text{O}_5\text{S} \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 60.40; H, 5.76; N, 6.40; S, 7.33 実測値 (%): C, 60.42; H, 5.78; N, 6.27; S, 6.97
lc-82	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.86-2.20 (m, 4H), 3.45-3.55 (m, 2H), 4.91 (s, 2H), 5.06 (m, 1H), 7.04-7.28 (m, 4H), 7.74 (m, 1H), 7.88 (m, 1H), 8.00 (dd, $J = 2.4$, 6.9 Hz, 2H), 8.10 (s, 1H); IR (KBr) 3433, 2929, 1738, 1626, 1590, 1528, 1493, 1394, 1344, 1293, 1233, 1153, 1092, 1062, 1010 cm^{-1} ;
lc-83	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.86-2.20 (m, 4H), 3.45-3.55 (m, 2H), 4.91 (s, 2H), 5.06 (m, 1H), 7.04-7.28 (m, 4H), 7.74 (m, 1H), 7.88 (m, 1H), 8.00 (dd, $J = 2.4$, 6.9 Hz, 2H), 8.10 (s, 1H); IR (KBr) 3433, 2929, 1738, 1626, 1590, 1528, 1493, 1394, 1344, 1293, 1233, 1153, 1092, 1062, 1010 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{22} +29.0 \pm 0.7^\circ$ ($c=1.001$, MeOH)
lc-84	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.433-1.72 (m, 4H), 2.89 (dd, $J = 9.3$ and 14.4 Hz, 1H), 3.10 (m, 1H), 3.27 (dd, $J = 3.9$ and 14.4 Hz, 1H), 3.41 (m, 1H), 3.87 (m, 1H), 4.84 (s, 2H), 6.95-7.02 (m, 2H), 7.11-7.26 (m, 3H), 7.40 (dd, $J = 2.4$ and 9.6 Hz, 1H), 7.85-7.91 (m, 2H); IR (CHCl_3) 1729, 1593, 1493, 1456, 1348, 1292, 1164, 1154, 1092 cm^{-1} ; $[\alpha]_{\text{D}}^{22} +109.6 \pm 1.5$ ($c=1.003$, MeOH)

(表 5 5)

化合物 番号	物性値
Ic-85	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.43-1.66 (m, 4H), 2.87 (dd, $J = 6.0$ and 14.1 Hz, 1H), 3.11 (m, 1H), 3.26 (dd, $J = 3.3$ and 14.1 Hz, 1H), 3.82 (m, 1H), 3.86 (s, 3H), 4.83 (s, 2H), 6.95-7.01 (m, 4H), 7.11 (dd, $J = 3.9$ and 8.7 Hz, 1H), 7.40 (dd, $J = 2.4$ and 9.3 Hz, 1H), 7.73-7.83 (m, 2H); IR (CHCl_3) 1730, 1626, 1597, 1578, 1497, 1487, 1457, 1338, 1304, 1260, 1155, 1094, 1030 cm^{-1} ; $[\alpha]_D^{22} +124.6 \pm 1.6$ ($c=1.002$, MeOH)
Id-2	mp 220-222 °C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.84 (t, $J = 5.7$ Hz, 2H), 3.57 (t, $J = 5.7$ Hz, 2H), 4.42 (s, 2H), 4.67 (s, 2H), 7.05-7.25 (m, 5H), 7.35-7.43 (m, 1H), 7.84-7.92 (m, 2H); IR (CHCl_3) 3428, 3048, 2927, 1727, 1595, 1494, 1467, 1345, 1240, 1169, 1103 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{17}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 58.75; H, 4.41; F, 4.89; N, 7.21; S, 8.26 実測値 (%): C, 58.58; H, 4.37; F, 4.69; N, 7.13; S, 8.08
Ie-2	mp 139-141 °C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 4.95 (s, 2H), 7.02-7.11 (m, 3H), 7.18-7.25 (m, 2H), 7.34 (m, 1H), 7.46 (t, $J = 7.7$ Hz, 1H), 7.68-7.73 (m, 2H), 7.80 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.99 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H); IR (Nujol) 3300, 3245, 3047, 1776, 1736, 1688, 1590, 1493, 1466, 1335, 1285, 1163, 1152 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{20}\text{H}_{15}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.6\text{CH}_3\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$) 計算値 (%): C, 59.62; H, 4.42; F, 4.21; N, 6.21; S, 7.11 実測値 (%): C, 59.45; H, 4.19; F, 4.14; N, 6.51; S, 7.02
Ie-5	mp 188-191 °C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 3.28 (d, $J = 1.5$ Hz, 3H), 5.02 (s, 2H), 7.09-7.33 (m, 6H), 7.49 (t, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.57-7.61 (m, 2H), 7.73 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 7.97 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H); IR (Nujol) 3102, 3049, 2728, 1727, 1628, 1591, 1491, 1292, 1228, 1210, 1173, 1150 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{17}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 60.63; H, 4.22; F, 4.57; N, 6.73; S, 7.71 実測値 (%): C, 60.52; H, 4.13; F, 4.46; N, 6.82; S, 7.63
Ie-8	mp 212-213 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 4.89 (s, 2H), 5.16 (s, 2H), 7.06 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 7.13-7.32 (m, 6H), 7.41-7.52 (m, 5H), 7.73-7.77 (m, 2H), 7.84 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 8.04 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 13.05 (br s, 1H); IR (Nujol) 3063, 3035, 2658, 1705, 1630, 1591, 1232, 1214, 1162 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{21}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 66.38; H, 4.33; F, 3.89; N, 5.73; S, 6.56 実測値 (%): C, 66.33; H, 4.26; F, 3.79; N, 5.80; S, 6.53
Ie-10	mp 171-175 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 5.15 (s, 2H), 6.98-7.07 (m, 2H), 7.32-7.47 (m, 4H), 7.74-7.81 (m, 3H), 8.05-8.10 (m, 2H), 10.10 (s, 1H); IR (Nujol) 3621, 3313, 3107, 3070, 2727, 1737, 1702, 1636, 1603, 1592, 1490, 1330, 1164, 1146 cm^{-1} .
Ie-11	mp 183-187 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 2.13 (s, 3H), 5.14 (s, 2H), 7.00-7.95 (m, 10H), 9.61 (s, 1H); IR (Nujol) 3517, 3236, 3105, 3068, 2732, 1735, 1635, 1607, 1591, 1494, 1408, 1335, 1270 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{17}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 60.10; H, 4.28; F, 4.53; N, 6.68; S, 7.64 実測値 (%): C, 60.28; H, 4.47; F, 4.42; N, 6.54; S, 7.52

(表 5 6)

化合物 番号	物性値
le-12	mp 201-203 °C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 3.26 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.95-7.02 (m, 2H), 7.09-7.20 (m, 4H), 7.56-7.61 (m, 2H), 7.72 (m, 1H), 7.89 (m, 1H); IR (Nujol) 3106, 3067, 2744, 2657, 2558, 1734, 1635, 1605, 1592, 1495, 1483, 1340, 1236 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{16}\text{F}_2\text{N}_2\text{O}_4\text{S}\cdot 0.2\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 58.44; H, 3.96; F, 8.48; N, 6.25; S, 7.16 実測値 (%): C, 58.49; H, 3.72; F, 8.33; N, 6.37; S, 7.16
le-13	mp 215-218 °C; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3+\text{CD}_3\text{OD}$) δ 4.82 (s, 2H), 4.86 (s, 2H), 6.92-7.02 (m, 3H), 7.14-7.24 (m, 9H), 7.60-7.86 (m, 3H); IR (Nujol) 3066, 3036, 2656, 1708, 1635, 1605, 1591, 1492, 1483, 1406, 1338, 1232 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{20}\text{F}_2\text{N}_2\text{O}_4\text{S}\cdot 0.2\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 63.70; H, 4.15; F, 7.25; N, 5.34; S, 6.12 実測値 (%): C, 63.79; H, 4.04; F, 6.99; N, 5.31; S, 6.11
le-14	mp 219-225 °C; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3+\text{CD}_3\text{OD}$) δ 2.56 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 7.09-7.23 (m, 5H), 7.31 (m, 1H), 7.44 (m, 1H), 7.73-7.77 (m, 3H); IR (Nujol) 2742, 2656, 2560, 1727, 1711, 1632, 1605, 1590, 1495, 1483, 1412, 1339, 1275 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}\cdot 0.2\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 61.67; H, 4.68; F, 4.28; N, 6.31; S, 7.22 実測値 (%): C, 61.82; H, 4.59; F, 4.00; N, 6.31; S, 7.14
le-15	mp 194-197 °C; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3+\text{CD}_3\text{OD}$) δ 2.13 (s, 3H), 4.36 (d, $J = 13.5$ Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 5.09 (d, $J = 13.5$ Hz, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.13-7.24 (m, 10H), 7.31 (m, 1H), 7.45 (t, $J = 7.2$ Hz, 1H), 7.73-7.78 (m, 2H); IR (Nujol) 3060, 3032, 2739, 2644, 2557, 1715, 1633, 1604, 1593, 1494, 1478, 1414, 1342, 1240 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{23}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}\cdot 0.2\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 66.50; H, 4.77; F, 3.65; N, 5.39; S, 6.16 実測値 (%): C, 66.74; H, 4.76; F, 3.39; N, 5.37; S, 6.04
le-16	mp 164-165 °C; $^1\text{H-NMR}$ ($d_6\text{-DMSO}$) δ 5.16 (s, 2H), 7.08 (dd, $J = 1.8, 9.0$ Hz, 1H), 7.52-7.45 (m, 4H), 7.54 (dd, $J = 4.2, 8.7$ Hz, 1H), 7.75-7.79 (m, 2H), 7.86 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.95 (dd, $J = 2.4, 9.3$ Hz, 1H), 10.09 (s, 1H); IR (Nujol) 3301, 3191, 3108, 1778, 1691, 1590, 1496, 1474, 1337, 1286 cm^{-1} .
le-17	mp 187-188 °C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 3.26 (s, 3H), 4.96 (s, 2H), 7.08-7.21 (m, 6H), 7.55-7.61 (m, 3H), 7.66 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H); IR (Nujol) 2747, 2650, 2566, 2483, 1720, 1593, 1492, 1414, 1348, 1295, 1254 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{16}\text{F}_2\text{N}_2\text{O}_4\text{S}\cdot 0.2\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 58.44; H, 3.96; F, 8.48; N, 6.25; S, 7.16 実測値 (%): C, 58.55; H, 3.77; F, 8.40; N, 6.23; S, 7.34
le-18	mp 189-191 °C; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3+\text{CD}_3\text{OD}$) δ 4.82 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 7.01 (dd, $J = 1.8, 8.7$ Hz, 1H), 7.14-7.27 (m, 10H), 7.56 (dd, $J = 2.4, 9.0$ Hz, 1H), 7.59 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.67-7.71 (m, 2H); IR (Nujol) 3089, 3074, 3033, 2742, 2653, 2558, 1710, 1591, 1343, 1296 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{20}\text{F}_2\text{N}_2\text{O}_4\text{S}\cdot 0.1\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 63.86; H, 4.07; F, 7.37; N, 5.44; S, 6.22 実測値 (%): C, 63.84; H, 3.95; F, 7.14; N, 5.31; S, 6.33

(表 5 7)

化合物 番号	物性値
le-19	Mp 189-191 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 5.19 (s, 2H), 6.99 (m, 1H), 7.21 (dd, J = 2.1, 9.0 Hz, 1H), 7.33-7.46 (m, 4H), 7.51 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.75-7.79 (m, 3H), 10.15 (s, 1H); IR (Nujol) 3262, 3103, 3061, 2661, 2558, 1715, 1640, 1611, 1590, 1484, 1406, 1331, 1294 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₁₄ F ₂ N ₂ O ₄ S·0.1AcOEt) 計算値 (%): C, 57.62; H, 3.51; F, 8.94; N, 6.59; S, 7.54 実測値 (%): C, 57.43; H, 3.26; F, 8.65; N, 6.46; S, 7.34
le-20	Mp 214-217 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 3.27 (s, 3H), 5.00 (s, 2H), 6.92 (dd, J = 8.1, 9.9 Hz, 1H), 7.06-7.17 (m, 3H), 7.23 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.32 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.39 (m, 1H), 7.56-7.63 (m, 2H), 7.70 (d, J = 1.8 Hz, 1H); IR (Nujol) 3087, 2748, 2651, 2568, 2486, 1723, 1637, 1592, 1493, 1308, 1236 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₁₆ F ₂ N ₂ O ₄ S·0.1AcOEt) 計算値 (%): C, 58.52; H, 3.86; F, 8.65; N, 6.38; S, 7.30 実測値 (%): C, 58.64; H, 3.61; F, 8.37; N, 6.39; S, 7.21
le-21	Mp 209-213 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃ +CD ₃ OD) δ 4.82 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 6.90 (dd, J = 8.1, 9.9 Hz, 1H), 7.08-7.13 (m, 2H), 7.15-7.28 (m, 8H), 7.38 (m, 1H), 7.65 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.68-7.73 (m, 2H); IR (Nujol) 3063, 3033, 2659, 1708, 1641, 1610, 1590, 1492, 1241 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₇ H ₂₀ F ₂ N ₂ O ₄ S·0.1AcOEt) 計算値 (%): C, 63.86; H, 4.07; F, 7.37; N, 5.44; S, 6.22 実測値 (%): C, 63.77; H, 3.90; F, 7.21; N, 5.45; S, 6.18
le-22	mp 153-156 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃ +CD ₃ OD) δ 5.13 (s, 2H), 6.92 (dd, J = 1.8, 10.4 Hz, 1H), 7.04-7.12 (m, 2H), 7.25 (td, J = 0.6, 15.0 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.49 (td, J = 1.2, 7.7 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.72-7.77 (m, 2H), 7.96 (d, J = 7.5 Hz, 1H); IR (Nujol) 3236, 3109, 3073, 3050, 2725, 1761, 1732, 1641, 1610, 1591, 1497, 1375, 1288 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₁₄ F ₂ N ₂ O ₄ S·0.2AcOEt) 計算値 (%): C, 57.56; H, 3.62; F, 8.75; N, 6.45; S, 7.39 実測値 (%): C, 57.27; H, 3.39; F, 8.82; N, 6.58; S, 7.49
le-23	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 3.25 (s, 3H), 5.22 (s, 2H), 6.91 (dd, J = 2.1, 12.9 Hz, 1H), 7.09-7.16 (m, 2H), 7.28-7.33 (m, 2H), 7.48-7.54 (m, 2H), 7.56-7.62 (m, 2H), 7.94 (d, J = 7.8 Hz, 1H); IR (Nujol) 3505, 3103, 3052, 2729, 2648, 1728, 1639, 1589, 1494, 1297, 1238 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₁₆ F ₂ N ₂ O ₄ S·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 57.87; H, 3.84; F, 8.72; N, 6.43; S, 7.36 実測値 (%): C, 57.99; H, 3.79; F, 8.55; N, 6.43; S, 7.07
le-24	mp 199-201 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃ +CD ₃ OD) δ 4.80 (s, 2H), 5.13 (s, 2H), 6.76 (dd, J = 2.1, 13.2 Hz, 1H), 7.17-7.28 (m, 8H), 7.32 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.49 (m, 1H), 7.67-7.74 (m, 2H), 7.89 (d, J = 7.5 Hz, 1H); IR (Nujol) 3087, 3062, 3032, 2644, 2560, 2470, 1714, 1638, 1585, 1493, 1300, 1249 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₇ H ₂₀ F ₂ N ₂ O ₄ S·0.1AcOEt) 計算値 (%): C, 63.86; H, 4.07; F, 7.37; N, 5.44; S, 6.22 実測値 (%): C, 64.07; H, 3.90; F, 7.17; N, 5.52; S, 6.10

(表 5 8)

化合物 番号	物性値
le-25	mp 204-206 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 3.27 (s, 3H), 5.22 (s, 2H), 7.09-7.22 (m, 6H), 7.56-7.61 (m, 2H), 7.71-7.74 (m, 2H); IR (Nujol) 3327, 3085, 3046, 2680, 1774, 1637, 1592, 1578, 1339, 1242 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₁₆ F ₂ N ₂ O ₄ S·0.1AcOEt) 計算値 (%): C, 58.52; H, 3.86; F, 8.65; N, 6.38; S, 7.30 実測値 (%): C, 58.60; H, 3.70; F, 8.51; N, 6.44; S, 7.46
le-26	mp 194-197 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 4.81 (s, 2H), 5.13 (s, 2H), 7.00 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.07-7.25 (m, 11H), 7.62-7.69 (m, 3H); IR (Nujol) 3093, 3066, 3040, 3023, 2657, 2561, 1722, 1593, 1581, 1493, 1294, 1236 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₇ H ₂₀ F ₂ N ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 64.02; H, 3.98; F, 7.50; N, 5.53; S, 6.33 実測値 (%): C, 64.00; H, 3.98; F, 7.26; N, 5.49; S, 6.13
le-27	mp 190-191 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃ +CD ₃ OD) δ 4.92 (s, 2H), 7.03-7.09 (m, 2H), 7.13-7.23 (m, 3H), 7.54 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.68-7.73 (m, 3H), 8.10 (d, J = 1.8 Hz, 1H); IR (Nujol) 3263, 3102, 3060, 2657, 1715, 1591, 1487, 1406, 1335, 1286 cm ⁻¹ .
le-28	mp 200-202 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃ +CD ₃ OD) δ 3.28 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 7.11-7.29 (m, 5H), 7.54-7.61 (m, 3H), 7.69 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 2.1 Hz); IR (Nujol) 3066, 2744, 2658, 2565, 1731, 1454, 1444, 1293, 1247, 1224 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₁₆ BrFN ₂ O ₄ S·0.4AcOEt) 計算値 (%): C, 51.55; H, 3.68; Br, 15.17; F, 3.61; N, 5.32; S, 6.09 実測値 (%): C, 51.74; H, 3.13; Br, 14.82; F, 3.66; N, 5.60; S, 6.28
lf-1	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.56 (s, 6H), 2.43 (s, 3H), 3.20 (d, J = 5.7 Hz, 2H), 4.21 (t, J = 5.7 Hz, 1H), 4.82 (s, 2H), 6.85-6.98 (m, 3H), 7.13-7.15 (m, 2H), 7.35 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.49-7.53 (m, 2H); IR (KBr) 3505, 1728, 1594, 1495, 1478, 1468, 1406, 1340, 1292, 1166, 1154, 1092, 1076 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S·0.6H ₂ O) 計算値 (%): C, 58.75; H, 5.68; N, 6.53; F, 4.43; S, 7.47 実測値 (%): C, 58.83; H, 5.73; N, 6.32; F, 4.29, S, 7.24
lf-2	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.68 (s, 6H), 2.28 (s, 3H), 2.52 (s, 3H), 3.40 (s, 2H), 4.83 (s, 2H), 7.05 (m, 1H), 7.13-7.18 (m, 4H), 7.71-7.77 (m, 3H); IR (CHCl ₃) 2976, 2930, 1729, 1594, 1495, 1479, 1467, 1393, 1342, 1293, 1166, 1155, 1089, 1015 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₅ FN ₂ O ₄ S·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 60.59; H, 5.87; N, 6.42; F, 4.36; S, 7.35 実測値 (%): C, 60.57; H, 6.01; N, 6.31; F, 4.26, S, 7.15
lf-3	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.58 (s, 6H), 2.10 (s, 3H), 3.71 (s, 2H), 3.96 (s, 2H), 4.56 (s, 2H), 6.47 (d, J = 7.2 Hz, 2H), 6.95-7.15 (m, 8H), 7.56 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.72-7.77 (m, 2H); IR (CHCl ₃) 1729, 1594, 1495, 1479, 1467, 1342, 1292, 1239, 1165, 1154, 1091, 1056 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₈ H ₂₉ FN ₂ O ₄ S·0.2MeOH) 計算値 (%): C, 65.77; H, 5.83; N, 5.44; F, 3.69; S, 6.23 実測値 (%): C, 66.15; H, 5.98; N, 5.23; F, 3.40, S, 5.87

(表 5 9)

化合物 番号	物性値
lf-4	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.38 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 2.29 (s, 3H), 3.07-3.36 (m, 3H), 4.29 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 4.81 (d, $J = 5.1$ Hz, 2H), 6.91-7.27 (m, 6H), 7.54-7.59 (m, 2H); IR (CHCl_3) 2976, 2930, 1729, 1594, 1495, 1479, 1467, 1393, 1342, 1293, 1166, 1155, 1089, 1015 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{20}\text{H}_{21}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 1.2\text{MeOH}$) 計算値 (%): C, 57.49; H, 5.87; N, 6.32; F, 4.29; S, 7.24 実測値 (%): C, 57.55; H, 5.65; N, 6.14; F, 4.22, S, 7.23
lf-5	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.48 (d, $J = 6.9$ Hz, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.57 (s, 3H), 3.02 (m, 1H), 3.36 (m, 1H), 3.65 (m, 1H), 4.82 (s, 2H), 7.04-7.17 (m, 5H), 7.58 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.68-7.73 (m, 2H); IR (CHCl_3) 2976, 2930, 1729, 1594, 1495, 1479, 1467, 1393, 1342, 1293, 1166, 1155, 1089, 1015 cm^{-1}
lf-6	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.31 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 2.17 (s, 3H), 3.15-3.23 (m, 2H), 3.70 (q, $J = 6.6$ Hz, 1H), 4.17 (s, 2H), 4.76 (s, 2H), 6.96-7.23 (m, 10H), 7.40 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.69-7.74 (m, 2H); IR (CHCl_3) 2974, 2932, 2876, 1731, 1594, 1496, 1468, 1409, 1339, 1292, 1240, 1165, 1153, 1089, 1022 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{27}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 1.1\text{MeOH}$) 計算値 (%): C, 63.70; H, 5.97; N, 5.29; F, 3.59; S, 6.05 実測値 (%): C, 64.02; H, 5.78; N, 5.20; F, 3.42, S, 5.70
lf-7	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.73-1.85 (m, 4H), 2.02-2.23 (m, 4H), 3.30 (s, 2H), 4.86 (s, 1H), 6.91 (s, 1H), 7.04-7.21 (m, 5H), 7.60 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.70-7.75 (m, 2H); IR (CHCl_3) 2961, 2874, 1594, 1494, 1468, 1340, 1292, 1240, 1155, 1089 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{25}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.2\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 61.65; H, 5.71; N, 6.25; F, 4.24; S, 7.16 実測値 (%): C, 61.74; H, 5.93; N, 5.96; F, 3.93, S, 6.95
lf-8	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.65-1.80 (m, 4H), 2.00-2.09 (m, 4H), 3.64 (s, 2H), 3.80 (s, 2H), 4.58 (s, 2H), 6.47 (s, 1H), 6.54 (d, $J = 7.8$ Hz, 2H), 6.97-7.15 (m, 7H), 7.37-7.45 (m, 2H), 7.67-7.72 (m, 2H); IR (CHCl_3) 2960, 2874, 1731, 1592, 1495, 1468, 1339, 1292, 1239, 1165, 1154, 1092, 1022 cm^{-1} .
lf-9	mp 117-120 $^{\circ}\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 3.50-3.69 (m, 2H), 4.34 (t, $J = 7.5$ Hz, 1H), 4.58 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H), 4.80 (d, $J = 18.3$ Hz, 1H), 4.81 (d, $J = 18.3$ Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.01 (m, 1H), 7.08 (t, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.17-7.30 (m, 8H), 7.72 (dd, $J = 5.1$ 9.0 Hz, 2H); IR (Nujol) 3351, 3295, 3063, 1727, 1706, 1614, 1592, 1494, 1468, 1406, 1331, 1241, 1165, 1152 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{21}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.4\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 63.04; H, 5.00; N, 5.74; F, 3.90; S, 6.57 実測値 (%): C, 62.73; H, 4.75; N, 5.77; F, 3.91; S, 6.58

(表 6 0)

化合物 番号	物性値
If-10	mp 167-170 °C; $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.61 (s, 3H), 3.36 (dd, $J = 7.8$, 13.5 Hz, 1H), 3.93 (dd, $J = 7.8$, 13.5 Hz, 1H), 4.55 (t, $J = 7.8$ Hz, 1H), 4.87 (s, 2H), 7.06 (m, 1H), 7.10 (s, 1H), 7.13 (t, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.20-7.31 (m, 7H), 7.43 (br d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.70 (dd, $J = 5.1$, 9.0 Hz, 2H); IR (Nujol) 3429, 3030, 1722, 1704, 1592, 1493, 1469, 1406, 1332, 1237, 1150, 1087 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{23}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 64.36; H, 4.97; N, 6.00; F, 4.07; S, 6.87 実測値 (%): C, 64.28; H, 4.93; N, 5.91; F, 3.85; S, 6.73
If-11	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.00-2.41 (m, 6H), 3.30 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.21 (t, $J = 5.7$ Hz, 1H), 4.84 (s, 2H), 6.82-6.98 (m, 4H), 7.13-7.27 (m, 3H), 7.45-7.50 (m, 2H); IR (CHCl_3) 2984, 2934, 2875, 1731, 1594, 1496, 1468, 1408, 1333, 1292, 1240, 1167, 1154 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{21}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 59.53; H, 5.19; N, 6.61; F, 4.48; S, 7.57 実測値 (%): C, 59.49; H, 5.23; N, 6.35; F, 4.20, S, 7.34
If-12	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.91-1.95 (m, 2H), 2.25-2.42 (m, 4H), 3.74 (s, 2H), 3.92 (s, 2H), 4.70 (s, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.67 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 6.97-7.38 (m, 9H), 7.62-7.67 (m, 2H); IR (CHCl_3) 2932, 1731, 1593, 1495, 1468, 1333, 1292, 1239, 1163, 1153, 1089 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{27}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.8\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 64.55; H, 5.53; N, 5.38; F, 3.65; S, 6.15 実測値 (%): C, 64.61; H, 5.27; N, 5.08; F, 3.35, S, 5.87
If-13	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.43 (s, 6H), 3.17 (d, $J = 5.7$ Hz, 2H), 4.20 (t, $J = 6.0$ Hz, 1H), 4.83 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 6.90-6.97 (m, 3H), 7.21 (d, $J = 3.6$ Hz, 2H), 7.32 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.49-7.54 (m, 2H); IR (CHCl_3) 2971, 2933, 2878, 1731, 1594, 1496, 1467, 1408, 1386, 1331, 1292, 1239, 1194, 1167, 1154, 1092, 1076 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{20}\text{H}_{21}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.5\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 58.10; H, 5.36; N, 6.78; F, 4.59; S, 7.76 実測値 (%): C, 58.05; H, 5.31; N, 6.55; F, 4.34, S, 7.58
If-14	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.54 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 3.37 (s, 2H), 4.86 (s, 2H), 6.89 (s, 1H), 7.07-7.22 (m, 5H), 7.69-7.77 (m, 3H); IR (CHCl_3) 2974, 2929, 1731, 1594, 1495, 1480, 1467, 1340, 1292, 1240, 1166, 1155, 1089, 1020 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{23}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 59.50; H, 5.61; N, 6.61; F, 4.48; S, 7.56 実測値 (%): C, 59.59; H, 5.62; N, 6.39; F, 4.26, S, 7.42
If-15	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.47 (s, 3H), 3.67 (s, 2H), 3.96 (s, 2H), 4.61 (s, 2H), 6.51-6.54 (m, 3H), 6.95-7.15 (m, 7H), 7.37 (d, $J = 4.8$ Hz, 1H), 7.48 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.71-7.76 (m, 2H); IR (CHCl_3) 2972, 2931, 1731, 1594, 1495, 1468, 1339, 1292, 1239, 1165, 1154, 1091, 1056 cm^{-1} .

(表 6 1)

化合物 番号	物性値
lf-16	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 2.91 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.34-3.49 (m, 2H), 4.63 (t, $J = 6.0$ Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 6.92-7.15 (m, 5H), 7.48-7.53 (m, 2H); IR (KBr) 3285, 2232, 1729, 1627, 1582, 1488, 1414, 1324, 1250, 1159, 1092, 1047 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{16}\text{H}_{15}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}_2 \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 49.55; H, 4.05; N, 7.22; F, 4.90; S, 16.54 実測値 (%): C, 49.89; H, 3.98; N, 6.98; F, 4.54, S, 16.12
lf-17	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.42 (s, 6H), 3.12 (s, 3H), 3.45 (br, 1H), 4.79 (s, 2H), 6.90-7.24 (m, 6H), 7.51-7.56 (m, 2H); IR (KBr) 3283, 2966, 2926, 1736, 1590, 1494, 1474, 1409, 1337, 1320, 1293, 1242, 1167, 1153 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{20}\text{H}_{20}\text{ClFN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 54.07; H, 4.67; N, 6.30; Cl, 7.98; F, 4.28; S, 7.22 実測値 (%): C, 54.06; H, 4.65; N, 6.26; Cl, 7.79; F, 4.13, S, 7.12
lf-18	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.52 (s, 6H), 2.22 (s, 3H), 3.32 (s, 2H), 4.83 (s, 2H), 6.92 (s, 1H), 7.14-7.21 (m, 4H), 7.63 (s, 1H), 7.74-7.78 (m, 2H); IR (CHCl_3) 2974, 2929, 1731, 1594, 1495, 1474, 1341, 1292, 1240, 1167, 1155, 1089, 1020 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{22}\text{ClFN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.3\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 55.03; H, 4.97; N, 6.11; Cl, 7.74; F, 4.15; S, 7.00 実測値 (%): C, 55.36; H, 5.13; N, 5.90; Cl, 7.34; F, 3.93; S, 7.00
lf-19	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.44 (s, 6H), 3.63 (s, 2H), 3.95 (s, 2H), 4.59 (s, 2H), 6.43 (d, $J = 7.8$ Hz, 2H), 6.57 (s, 1H), 6.94-7.17 (m, 5H), 7.33-7.38 (m, 3H), 7.75-7.80 (m, 2H); IR (CHCl_3) 1732, 1594, 1495, 1475, 1341, 1292, 1165, 1154, 1091, 1056 cm^{-1} .
lf-20	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 3.05-3.10 (m, 2H), 3.51-3.56 (m, 2H), 4.44 (s, 2H), 5.00 (s, 2H), 7.07-7.13 (m, 3H), 7.24-7.44 (m, 8H), 7.70-7.82 (m, 2H); IR (KBr) 1736, 1622, 1589, 1509, 1492, 1455, 1320, 1230, 1162, 1148, 1096 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{24}\text{H}_{22}\text{FN}_3\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 61.66; H, 4.74; N, 8.99; F, 4.06; S, 6.86 実測値 (%): C, 61.53; H, 4.72; N, 8.91; F, 3.91, S, 6.53
lg-1	mp 217-219 $^{\circ}\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 2.36-2.79 (m, 6H), 4.80 (s, 2H), 6.71 (dd, $J = 2.1, 8.4$ Hz, 1H), 7.00 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.17 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.31-7.37 (m, 2H), 7.69-7.74 (m, 2H), 9.83 (s, 1H), 13.00 (br, 1H); IR (Nujol) 2926, 1725, 1592, 1492, 1476, 1347, 1237, 1149 cm^{-1} ; IR (Nujol) 3207, 2925, 2853, 1738, 1587, 1464, 1150 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{17}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 58.75; H, 4.41; F, 4.89; N, 7.21; S, 8.26 実測値 (%): C, 58.71; H, 4.39; F, 4.65; N, 7.07; S, 8.03
lg-2	mp 223-226 $^{\circ}\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 2.80-2.88 (m, 2H), 2.94-3.00 (m, 2H), 3.69 (s, 2H), 4.85 (s, 2H), 6.75 (dd, $J = 1.8, 8.4$ Hz, 1H), 7.12 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.23 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.29-7.39 (m, 2H), 7.68-7.77 (m, 2H), 9.96 (br s, 1H); IR (Nujol) 3228, 3105, 3070, 3047, 2924, 2854, 1734, 1590, 1467, 1332, 1226, 1182, 1167, 1151 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{17}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}_2 \cdot 0.3\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 54.28; H, 4.18; F, 4.43; N, 6.53; S, 14.94 実測値 (%): C, 54.05; H, 3.98; F, 4.29; N, 6.55; S, 14.92

(表 6 2)

化合物 番号	物性値
lg-3	mp 214-217°C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 2.81-2.92 (m, 2H), 2.93-3.03 (m, 2H), 3.17 (s, 3H), 3.70 (s, 2H), 4.92 (s, 2H), 6.72 (dd, $J = 2.1$, 8.7 Hz, 1H), 7.12 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.33 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.38-7.48 (m, 2H), 7.56-7.64 (m, 2H), 13.08 (br, 1H); IR (Nujol) 3103, 2923, 2742, 2656, 2554, 1724, 1591, 1478, 1342, 1239, 1169, 1147 cm^{-1}
lg-4	mp 218-220 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 2.05-2.18 (m, 2H), 2.43 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 2.90 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.18 (s, 3H), 5.09 (s, 2H), 6.91 (dd, $J = 2.1$, 8.7 Hz, 1H), 7.38-7.45 (m, 2H), 7.49 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.57-7.62 (m, 2H), 7.66 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H); IR (Nujol) 3501, 3335, 2925, 2854, 1714, 1631, 1592, 1473, 1454, 1343, 1265, 1239, 1172, 1152 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_5\text{S}\cdot\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 56.24; H, 4.72; F, 4.24; N, 6.25; S, 7.15 実測値 (%): C, 56.18; H, 4.72; F, 4.14; N, 6.15; S, 7.07
lg-5	mp 220-222 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 0.94 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.40-1.57 (m, 1H), 1.72-2.00 (m, 2H), 2.19-2.40 (m, 2H), 2.80-3.06 (m, 2H), 3.18 (s, 3H), 5.08 (s, 2H), 6.90 (dd, $J = 2.1$, 8.7 Hz, 1H), 7.38-7.45 (m, 2H), 7.48 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.57-7.62 (m, 2H), 7.68 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 13.30 (br, 1H); IR (Nujol) 2924, 2854, 1733, 1593, 1534, 1477, 1464, 1353, 1206, 1172 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{23}\text{FN}_2\text{O}_5\text{S}$) 計算値 (%): C, 60.25; H, 5.06; F, 4.14; N, 6.11; S, 6.99 実測値 (%): C, 60.04; H, 5.15; F, 3.90; N, 6.07; S, 6.78
lg-6	mp 128-130°C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.22 (t, $J = 6.0$ Hz, 3H), 2.67 (br t, 2H), 3.72 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.09 (q, $J = 7.2$ Hz, 2H), 4.47 (s, 2H), 4.84 (s, 2H), 6.77 (dd, $J = 1.8$, 8.4 Hz, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.26 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.31-7.37 (m, 2H), 7.70-7.75 (m, 2H), 9.88 (s, 1H), 13.00 (br 1H); IR (Nujol) 3187, 2925, 2854, 1764, 1678, 1585, 1468, 1448, 1269, 1235, 1171, 1158 cm^{-1} .
lg-7	mp 200-202°C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.22 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 2.71 (br t, 2H), 3.18 (s, 3H), 3.74 (br t, 2H), 4.09 (q, $J = 7.2$ Hz, 2H), 4.49 (s, 2H), 4.92 (s, 2H), 6.79 (dd, $J = 1.8$, 9.0 Hz, 1H), 7.10 (br, 1H), 7.35 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.39-7.45 (m, 2H), 7.56-7.62 (m, 2H), 13.00 (br 1H); IR (Nujol) 2925, 2854, 1697, 1677, 1476, 1340, 1238, 1147 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{24}\text{FN}_3\text{O}_6\text{S}\cdot 0.4\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 55.61; H, 5.03; F, 3.82; N, 8.46; S, 6.46 実測値 (%): C, 55.58; H, 5.10; F, 3.71; N, 8.39; S, 6.41
lg-8	mp 229-232°C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.22 (t, $J = 6.9$ Hz, 3H), 2.67 (br t, 2H), 3.72 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.77 (s, 3H), 4.06 (q, $J = 7.2$ Hz, 2H), 4.47 (s, 2H), 4.85 (s, 2H), 6.69 (dd, $J = 2.1$, 8.7 Hz, 1H), 7.07 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.99-7.03 (m, 2H), 7.23 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.59-7.63 (m, 2H); IR (Nujol) 3309, 3218, 2925, 2853, 1741, 1644, 1598, 1491, 1259, 1247, 1155 cm^{-1} .

(表 6 3)

化合物 番号	物性値
lg-9	mp 232-234°C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.22 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 2.71 (br t, 2H), 3.13 (s, 3H), 3.74 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 3.85 (s, 3H), 4.09 (q, J = 6.9 Hz, 2H), 4.49 (s, 2H), 4.92 (s, 2H), 6.79 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.08-7.11 (m, 3H), 7.34 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.43-7.47 (m, 2H); IR (Nujol) 3143, 2925, 2854, 1722, 1690, 1598, 1497, 1472, 1229, 1163 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₇ N ₈ O ₇ S) 計算値 (%): C, 57.47; H, 5.43; N, 8.38; S, 6.39 実測値 (%): C, 57.48; H, 5.41; N, 8.28; S, 6.23
lg-10	mp 245-250°C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO at 80°C) δ 2.11 (s, 3H), 2.78 (br, 2H), 3.14 (s, 3H), 3.80 (br, 2H), 3.85 (s, 3H), 4.55 (s, 2H), 4.85 (s, 2H), 6.80 (br d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.05-7.08 (m, 3H), 7.28 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.47-7.51 (m, 2H); IR (Nujol) 2923, 2853, 1737, 1596, 1474, 1340, 1259, 1162 cm ⁻¹ .
lg-11	mp 209-211 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.60-1.90 (m, 6H), 2.60-2.76 (m, 4H), 4.87 (s, 2H), 6.69 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.17 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.31-7.38 (m, 2H), 7.70-7.75 (m, 2H), 9.80 (s, 1H), 12.90 (br, 1H); IR (Nujol) 3220, 2922, 2854, 1733, 1593, 1482, 1323, 1194, 1149 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₁ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 60.56; H, 5.08; F, 4.56; N, 6.73; S, 7.70 実測値 (%): C, 60.48; H, 4.92; F, 4.32; N, 6.68; S, 7.56
lg-12	mp 157-160 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.70-1.93 (m, 6H), 2.66-2.79 (m, 4H), 3.22 (s, 3H), 4.83 (s, 2H), 6.80 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.08-7.16 (m, 3H), 7.57-7.63 (m, 2H); IR (Nujol) 2923, 2853, 1725, 1592, 1480, 1346, 1235, 1148 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 61.38; H, 5.39; F, 4.41; N, 6.51; S, 7.45 実測値 (%): C, 60.98; H, 5.42; F, 4.10; N, 6.41; S, 7.43
lg-13	mp 155-157 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃) δ 1.60-1.92 (m, 6H), 2.60-2.74 (m, 4H), 4.76 (s, 4H), 6.66 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.09-7.28 (m, 7H), 7.65-7.70 (m, 2H); IR (Nujol) 2923, 2854, 1726, 1593, 1479, 1346, 1241, 1167, 1153 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₈ H ₂₇ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 66.39; H, 5.37; F, 3.75; N, 5.53; S, 6.33 実測値 (%): C, 66.39; H, 5.40; F, 3.53; N, 5.51; S, 6.09
lg-14	mp 144-150 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.61-1.76(m, 4H), 1.78-1.90 (m, 2H), 2.60-2.76 (m, 4H), 3.13 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 4.93 (s, 2H), 6.64 (dd, J = 1.8, 8.4 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.07-7.10 (m, 2H), 7.35 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.45-7.49 (m, 2H); IR (Nujol) 2926, 2853, 1727, 1596, 1496, 1477, 1353, 1256, 1243, 1162, 1151 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₃ H ₂₆ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 62.42; H, 5.92; N, 6.33; S, 7.25 実測値 (%): C, 62.72; H, 5.83; N, 6.18; S, 7.08

(表 6 4)

化合物 番号	物性値
lg-15	mp 151-155 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.97 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.61-1.76 (m, 4H), 1.78-1.90 (m, 2H), 2.62-2.76 (m, 4H), 3.60 (q, J = 6.9 Hz, 2H), 4.94 (s, 2H), 6.58 (dd, J = 1.8, 8.4 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.38-7.45 (m, 2H), 7.63-7.68 (m, 2H); IR (Nujol) 2924, 2854, 1728, 1592, 1478, 1345, 1233, 1170, 1143 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₃ H ₂₆ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 62.14; H, 5.67; F, 4.27; N, 6.30; S, 7.21 実測値 (%): C, 61.99; H, 5.39; F, 4.08; N, 6.31; S, 7.04
lg-16	mp 186-189 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.60-1.76 (m, 4H), 1.78-1.90 (m, 2H), 2.60-2.80 (m, 4H), 3.10 (s, 3H), 4.94 (s, 2H), 6.64 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 6.85-6.89 (m, 2H), 7.03 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.33-7.37 (m, 2H), 10.47 (br s, 1H), 12.96 (br s, 1H); IR (Nujol) 3400, 2924, 2853, 1722, 1600, 1586, 1498, 1476, 1444, 1321, 1251, 1144 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₄ N ₂ O ₅ S·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 60.90; H, 5.71; N, 6.46; S, 7.39 実測値 (%): C, 60.85; H, 5.38; N, 6.25; S, 7.18
lg-17	mp 264-266 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.96-2.07 (m, 2H), 2.97 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 3.13-3.20 (m, 2H), 3.17 (s, 3H), 5.02 (s, 2H), 6.82 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.37-7.45 (m, 3H), 7.55-7.64 (m, 3H), 7.96 (d, J = 2.1 Hz, 1H); IR (Nujol) 3521, 3381, 2924, 2854, 1713, 1614, 1592, 1528, 1476, 1445, 1339, 1254 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₀ FN ₃ O ₅ S·H ₂ O) 計算値 (%): C, 54.42; H, 4.78; F, 4.10; N, 9.07; S, 6.92 実測値 (%): C, 54.43; H, 4.82; F, 3.96; N, 8.83; S, 6.67
lg-18	mp 193-197 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.32-1.68 (m, 8H), 2.63-2.79 (m, 4H), 4.85 (s, 2H), 6.73 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.17 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.31-7.37 (m, 2H), 7.70-7.75 (m, 2H), 9.79 (s, 1H); IR (Nujol) 3280, 2924, 2853, 1703, 1594, 1475, 1331, 1291, 1244, 1167, 1153 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 61.38; H, 5.39; F, 4.41; N, 6.51; S, 7.47 実測値 (%): C, 61.21; H, 5.31; F, 4.29; N, 6.42; S, 7.47
lg-19	mp 175-177 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.35-1.71 (m, 8H), 2.66-2.82 (m, 4H), 3.18 (s, 3H), 4.92 (s, 2H), 6.71 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.98 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.37-7.43 (m, 3H), 7.57-7.62 (m, 2H); IR (Nujol) 2925, 2851, 1729, 1590, 1478, 1347, 1243, 1162, 1150 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₃ H ₂₅ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 62.14; H, 5.67; F, 4.27; N, 6.30; S, 7.21 実測値 (%): C, 62.01; H, 5.72; F, 4.01; N, 6.15; S, 7.08
lg-20	mp 188-192 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.32-1.70 (m, 8H), 2.60-2.78 (m, 4H), 4.81 (s, 2H), 4.86 (s, 2H), 6.66 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.15-7.29 (m, 6H), 7.43-7.46 (m, 2H), 7.70-7.75 (m, 2H); IR (Nujol) 2924, 2853, 1713, 1596, 1474, 1343, 1164, 1153 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₉ H ₂₉ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 66.90; H, 5.61; F, 3.65; N, 5.38; S, 6.16 実測値 (%): C, 66.87; H, 5.59; F, 3.52; N, 5.37; S, 6.01

(表 6 5)

化合物 番号	物性値
lg-21	mp 165-175 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 2.38-2.79 (m, 6H), 3.16 (s, 3H), 4.88 (s, 2H), 6.67 (dd, J = 2.1, 8.4 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.38-7.45 (m, 2H), 7.56-7.61 (m, 2H); IR (Nujol) 2924, 2855, 1730, 1592, 1469, 1343, 1242, 1234, 1150 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₁₉ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 59.69; H, 4.76; F, 4.72; N, 6.96; S, 7.97 実測値 (%): C, 59.73; H, 4.72; F, 4.69; N, 6.90; S, 7.90
lg-22	mp 261-265 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 2.80-3.15 (m, 4H), 3.88 (d, J = 15.3 Hz, 1H), 4.09 (d, J = 15.3 Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 6.75 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.29-7.39 (m, 2H), 7.67-7.76 (m, 2H), 9.89 (br s, 1H), 13.04 (br, 1H); IR (Nujol) 3560, 3316, 3166, 3102, 3069, 2924, 2724, 2599, 2506, 1896, 1717, 1590, 1466, 1242, 1227, 1166, 1155 cm ⁻¹
lg-23	mp 239-244 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 2.90-3.15 (m, 4H), 3.17 (s, 3H), 3.90 (d, J = 15.3 Hz, 1H), 4.10 (d, J = 15.3 Hz, 1H), 4.97 (s, 2H), 6.75 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.20 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.35 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.40-7.47 (m, 2H), 7.55-7.64 (m, 2H), 13.13 (br, 1H); IR (Nujol) 1718, 1590, 1479, 1348, 1234, 1152 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₁₉ FN ₂ O ₅ S ₂) 計算値 (%): C, 53.32; H, 4.25; F, 4.22; N, 6.22; S, 14.24 実測値 (%): C, 53.15; H, 4.47; F, 4.20; N, 6.19; S, 14.23
lg-24	mp 251-254 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.96-2.05 (m, 2H), 2.93 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 3.11-3.20 (m, 2H), 3.76 (s, 3H), 4.94 (s, 2H), 6.92 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.98-7.03 (m, 2H), 7.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.50 (t, J = 5.1 Hz, 1H), 7.58-7.63 (m, 2H), 8.00 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.73 (s, 1H); IR (Nujol) 3429, 3171, 2924, 2853, 1745, 1595, 1577, 1481, 1450, 1269, 1154 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₁ N ₃ O ₆ S·H ₂ O) 計算値 (%): C, 54.65; H, 5.02; N, 9.11; S, 6.95 実測値 (%): C, 54.58; H, 4.58; N, 9.05; S, 7.00
lg-25	mp 251-254 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.96-2.05 (m, 2H), 2.97 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 3.12 (s, 3H), 3.12-3.21 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 5.01 (s, 2H), 6.81 (dd, J = 2.1, 9.0 Hz, 1H), 7.05-7.11 (m, 2H), 7.37 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.44-7.49 (m, 2H), 7.57 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 13.2 (br, 1H); IR (Nujol) 3451, 3316, 2925, 2854, 1747, 1721, 1612, 1596, 1534, 1475, 1444, 1339, 1258 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₃ N ₃ O ₆ S·1.1H ₂ O) 計算値 (%): C, 55.36; H, 5.32; N, 8.80; S, 6.72 実測値 (%): C, 55.21; H, 5.10; N, 8.85; S, 6.84
lg-26	dp 217-219 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.84-2.00 (m, 2H), 2.64-2.81 (m, 4H), 3.16 (s, 3H), 4.98 (s, 2H), 6.75 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.35-7.61 (m, 5H), 7.74 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 10.39 (s, 1H), 13.0 (br, 1H); IR (Nujol) 3400, 2925, 2854, 1705, 1605, 1590, 1476, 1459, 1418, 1377, 1316, 1231, 1170, 1157 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₀ FN ₃ O ₅ S) 計算値 (%): C, 56.62; H, 4.53; F, 4.26; N, 9.43; S, 7.20 実測値 (%): C, 56.59; H, 4.39; F, 4.37; N, 9.26; S, 7.12

(表 6 6)

化合物 番号	物性値
lg-27	dp 203-208 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.84-1.97 (m, 2H), 2.60-2.78 (m, 4H), 3.18 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.99 (s, 2H), 6.85 (dd, $J = 2.1$, 8.7 Hz, 1H), 7.38-7.66 (m, 6H), 7.74 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 13.0 (br, 1H); IR (Nujol) 3179, 2925, 2854, 1736, 1592, 1471, 1376, 1345, 1172, 1149 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{22}\text{FN}_3\text{O}_5\text{S}$) 計算値 (%): C, 57.51; H, 4.83; F, 4.13; N, 9.14; S, 6.98 実測値 (%): C, 57.40; H, 4.65; F, 4.18; N, 8.95; S, 7.03
lh-1	mp 218-222 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.65-1.88 (m, 4H), 2.50-2.60 (m, 4H), 4.79 (s, 2H), 6.72 (dd, $J = 1.2$, 9.0 Hz, 1H), 7.03 (d, $J = 1.2$ Hz, 1H), 7.18 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.31-7.37 (m, 2H), 7.69-7.75 (m, 2H), 9.80 (s, 1H), 12.90 (br, 1H); IR (Nujol) 3221, 2925, 2854, 1737, 1587, 1478, 1403, 1231 cm^{-1} .
lh-2	mp 179-182 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.70-1.90 (m, 4H), 2.50-2.64 (m, 4H), 3.17 (s, 3H), 4.86 (s, 2H), 6.69 (dd, $J = 2.1$, 8.4 Hz, 1H), 7.00 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.27 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.39-7.49 (m, 2H), 7.58-7.63 (m, 2H); IR (Nujol) 2926, 1725, 1592, 1492, 1476, 1347, 1237, 1149 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{21}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 60.56; H, 5.08; F, 4.56; N, 6.73; S, 7.70 実測値 (%): C, 60.38; H, 5.07; F, 4.44; N, 6.73; S, 7.71
lh-3	mp 198-202 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.64-1.86 (m, 4H), 2.44-2.60 (m, 4H), 4.80 (s, 4H), 6.64 (dd, $J = 1.8$, 8.7 Hz, 1H), 6.93 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.16-7.30 (m, 6H), 7.40-7.49 (m, 2H), 7.68-7.78 (m, 2H); IR (Nujol) 2924, 2854, 1727, 1594, 1494, 1475, 1346, 1243 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{27}\text{H}_{25}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 65.84; H, 5.12; F, 3.86; N, 5.69; S, 6.51 実測値 (%): C, 65.53; H, 5.11; F, 3.73; N, 5.63; S, 6.30
lh-4	mp 180-183 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.07 (d, $J = 6.9$ Hz, 3H), 1.44 (m, 1H), 1.74-1.98 (m, 2H), 2.10 (m, 1H), 2.52-2.70 (m, 3H), 4.78 (s, 2H), 6.72 (dd, $J = 2.1$, 8.7 Hz, 1H), 7.02 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 7.17 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.30-7.40 (m, 2H), 7.68-7.78 (m, 2H), 9.80 (br s, 1H), 12.91 (br, 1H); IR (Nujol) 3217, 2953, 2853, 2721, 1733, 1567, 1418, 1321, 1298, 1180, 1143 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{21}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 60.56; H, 5.08; F, 4.56; N, 6.73; S, 7.70 実測値 (%): C, 60.35; H, 5.09; F, 4.41; N, 6.66; S, 7.67
lh-5	mp 100-101 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.07 (d, $J = 6.9$ Hz, 3H), 1.46 (m, 1H), 1.74-1.94 (m, 2H), 2.10 (m, 1H), 2.40-2.75 (m, 3H), 3.17 (s, 3H), 4.83 (s, 2H), 6.67 (dd, $J = 2.1$, 8.4 Hz, 1H), 7.00 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.17 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.38-7.48 (m, 2H), 7.55-7.63 (m, 2H), 12.90 (br, 1H); IR (Nujol) 3103, 3068, 2854, 2726, 1726, 1619, 1475, 1346, 1293, 1235, 1171 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{23}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.2\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 61.11; H, 5.53; F, 4.24; N, 6.25; S, 7.16 実測値 (%): C, 60.90; H, 5.44; F, 4.01; N, 6.43; S, 7.38

(表 6 7)

化合物 番号	物性値
lh-6	mp 176-178 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.06 (d, $J = 6.9$ Hz, 3H), 1.41 (m, 1H), 1.70-1.84 (m, 2H), 2.08 (m, 1H), 2.42-2.70 (m, 3H), 4.79 (s, 4H), 6.64 (dd, $J = 2.1, 8.4$ Hz, 1H), 7.00 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.17 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.14-7.30 (m, 5H), 7.40-7.50 (m, 2H), 7.66-7.76 (m, 2H), 12.99 (br, 1H); IR (Nujol) 3106, 2854, 1717, 1594, 1494, 1291, 1251, 1235, 1188, 1165, 1154 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{28}\text{H}_{27}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 66.39; H, 5.37; F, 3.75; N, 5.53; S, 6.33 実測値 (%): C, 66.19; H, 5.36; F, 3.52; N, 5.43; S, 6.33
lh-7	mp 205-210 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.85-1.91 (m, 4H), 2.40-2.75 (m, 4H), 3.20 (s, 3H), 4.86 (s, 2H), 6.61 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 7.02 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.22 (dd, $J = 3.6, 5.1$ Hz, 1H), 7.28 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.45 (dd, $J = 1.5, 3.6$ Hz, 1H), 8.00 (dd, $J = 1.5, 5.1$ Hz, 1H), 12.85 (br, 1H); IR (Nujol) 3099, 3085, 2924, 2741, 2653, 2552, 1722, 1578, 1476, 1348, 1310, 1240, cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}_2 \cdot 0.2\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 56.42; H, 4.98; N, 6.93; S, 15.85 実測値 (%): C, 56.30; H, 5.24; N, 6.50; S, 14.88
lh-8	mp 134-136 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 0.86 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.30-1.46 (m, 2H), 1.58-1.70 (m, 2H), 1.72-1.90 (m, 4H), 2.54-2.66 (m, 4H), 3.03-3.12 (m, 2H), 3.26 (s, 3H), 4.87 (s, 2H), 7.07 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 7.32 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.38 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 12.98 (br, 1H); IR (Nujol) 3042, 2923, 2739, 2650, 2549, 1723, 1583, 1411, 1385, 1323, 1234, 1213, 1136 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{26}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 60.29; H, 6.92; N, 7.40; S, 8.46 実測値 (%): C, 60.41; H, 6.77; N, 7.37; S, 8.16
lh-9	mp 222-225 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.66-1.88 (m, 4H), 2.40-2.64 (m, 4H), 4.81 (s, 4H), 6.68 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 6.97 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.12 (m, 7H), 7.57 (dd, $J = 1.2, 3.6$ Hz, 1H), 8.02 (dd, $J = 1.2, 5.1$ Hz, 1H), 12.97 (br, 1H); IR (Nujol) 3122, 2923, 2737, 2652, 2558, 1722, 1584, 1403, 1349, 1155 cm^{-1} .
lh-10	mp 143-145 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 0.90 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.34-1.50 (m, 2H), 1.66-1.89 (m, 6H), 2.50-2.60 (m, 4H), 3.11-3.22 (m, 2H), 4.81 (s, 2H), 4.88 (s, 2H), 6.99 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 7.14-7.23 (m, 6H), 7.30 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 12.99 (br, 1H); IR (Nujol) 3030, 2853, 2728, 2647, 1725, 1582, 1408, 1385, 1296, 1134 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{25}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 66.05; H, 6.65; N, 6.16; S, 7.00 実測値 (%): C, 65.67; H, 6.40; N, 6.21; S, 6.95
lh-11	mp 218-220 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.70-1.90 (m, 4H), 2.46-2.66 (m, 4H), 4.80 (s, 2H), 6.77 (dd, $J = 1.8, 8.7$ Hz, 1H), 7.06-7.10 (m, 2H), 7.20 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.38 (dd, $J = 2.1, 4.2$ Hz, 1H), 7.82 (dd, $J = 2.1, 5.4$ Hz, 1H), 9.90 (br s, 1H), 12.96 (br, 1H); IR (Nujol) 3099, 2854, 2741, 2653, 2552, 1722, 1578, 1508, 1439, 1385, 1348, 1310, 1240, 1151 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{18}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}_2 \cdot 0.2\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 55.33; H, 4.84; N, 6.86; S, 15.71 実測値 (%): C, 55.14; H, 4.61; N, 7.05; S, 15.77

(表 6 8)

化合物 番号	物性値
lh-12	mp 174-176 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.70-1.90 (m, 4H), 2.40-2.64 (m, 4H), 3.12 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.68 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 12.97 (br, 1H); IR (Nujol) 2925, 2746, 2662, 2563, 1727, 1709, 1595, 1474, 1380, 1350, 1246, 1149 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 61.67; H, 5.65; N, 6.54; S, 7.48 実測値 (%): C, 61.40; H, 5.69; N, 6.44; S, 7.22
lh-13	mp 225-228 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.66-1.96 (m, 4H), 2.44-2.60 (m, 4H), 4.77 (s, 2H), 6.72 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.00 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 9.51 (br s, 1H), 12.99 (br, 1H); IR (Nujol) 3456, 3289, 2924, 1720, 1590, 1284, 1260, 1145 cm ⁻¹ .
lh-14	mp 189-194 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.68-1.86 (m, 4H), 2.44-2.60 (m, 4H), 3.76 (s, 3H), 4.78 (s, 2H), 6.73 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 6.97 (m, 3H), 7.08 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 9.52 (br s, 1H), 12.92 (br, 1H); IR (Nujol) 3296, 3203, 2924, 1723, 1403, 1295, 1145 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₂ N ₂ O ₅ S·0.3AcOEt) 計算値 (%): C, 60.85; H, 5.35; N, 6.76; S, 7.74 実測値 (%): C, 60.47; H, 5.58; N, 6.35; S, 7.27
lh-15	mp 114-118 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.70-1.90 (m, 4H), 2.44-2.66 (m, 4H), 3.10 (s, 3H), 4.84 (s, 2H), 6.68 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.97 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 12.99 (br, 1H); IR (Nujol) 3376, 2924, 1728, 1586, 1499, 1376, 1329, 1283, 1226, 1147 cm ⁻¹ .
lh-16	mp 182-185 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.98 (t, J = 9.9 Hz, 3H), 1.35-1.64 (m, 4H), 1.90-2.18 (m, 2H), 2.50-2.70 (m, 3H), 4.80 (s, 2H), 6.72 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.18 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.32-7.38 (m, 2H), 7.70-7.75 (m, 2H), 9.83 (s, 1H); IR (Nujol) 3287, 2956, 2922, 2853, 1722, 1590, 1492, 1469, 1404, 1254, 1163, 1148 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 61.38; H, 5.39; F, 4.41; N, 6.51; S, 7.45 実測値 (%): C, 61.25; H, 5.36; F, 4.30; N, 6.43; S, 7.19
lh-17	mp 186-188 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.98 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.37-1.64 (m, 4H), 1.92-2.18 (m, 2H), 2.50-2.70 (m, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.79 (s, 2H), 6.74 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.00-7.17 (m, 4H), 7.59-7.63 (m, 2H), 9.65 (s, 1H); IR (Nujol) 3223, 2924, 2853, 1727, 1594, 1260, 1143 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₃ H ₂₆ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 62.42; H, 5.93; N, 6.33; S, 7.11 実測値 (%): C, 62.21; H, 5.88; N, 6.27; S, 7.11
lh-18	mp 153-155 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.97 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.35-1.68 (m, 4H), 1.90-2.18 (m, 2H), 2.54-2.72 (m, 3H), 3.17 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.69 (dd, J = 2.1, 8.4 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.26 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.38-7.45 (m, 2H), 7.57-7.62 (m, 2H); IR (Nujol) 2924, 1719, 1592, 1476, 1345, 1237, 1146 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₃ H ₂₅ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 62.14; H, 5.67; F, 4.27; N, 6.30; S, 7.21 実測値 (%): C, 62.38; H, 5.84; F, 4.00; N, 6.10; S, 6.83

(表 6 9)

化合物 番号	物性値
lh-19	mp 119-122 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.97 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.37-1.70 (m, 4H), 1.92-2.18 (m, 2H), 2.50-2.74 (m, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.69 (dd, J = 2.1, 8.4 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.07-7.10 (m, 2H), 7.24 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.44-7.48 (m, 2H); IR (Nujol) 2925, 1719, 1597, 1579, 1476, 1342, 1245, 1150 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₈ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 63.14; H, 6.18; N, 6.14; S, 7.02 実測値 (%): C, 63.30; H, 6.38; N, 5.94; S, 6.61
lh-20	mp 193-200°C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.65-1.86 (m, 4H), 2.46-2.60 (m, 4H), 4.78 (s, 2H), 6.73 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.45-7.60 (m, 3H), 7.65-7.72 (m, 2H), 9.78 (s, 1H), 12.93(brs, 1H); IR (Nujol) 3206, 1765, 1735, 1584, 1478, 1459, 1448, 1435, 1398, 1366, 1349, 1334, 1309, 1282, 1265, 1236, 1204, 1147 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₂₀ N ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 62.48; H, 5.24; N, 7.29; S, 8.34 実測値 (%): C, 62.29; H, 5.23; N, 7.18; S, 8.24
lh-21	mp 182-190°C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.67-1.87 (m, 4H), 2.30 (s, 3H), 2.46-2.60 (m, 4H), 4.78 (s, 2H), 6.73 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.56 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 9.71 (s, 1H), 12.93 (br s, 1H); IR (Nujol) 3222, 3114, 3062, 1756, 1738, 1596, 1478, 1456, 1417, 1404, 1381, 1365, 1346, 1322, 1303, 1291, 1280, 1260, 1194, 1146 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₂ N ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 63.30; H, 5.56; N, 7.03; S, 8.05 実測値 (%): C, 63.21; H, 5.53; N, 6.99; S, 7.98
lh-22	mp 199-205°C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.68-1.88 (m, 4H), 2.44-2.64 (m, 4H), 3.16 (s, 3H), 4.86 (s, 2H), 6.67 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.97 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.51-7.62 (m, 4H), 7.70 (m, 1H), 12.99 (br s, 1H); IR (Nujol) 3063, 2743, 2653, 2552, 2454, 1721, 1738, 1615, 1579, 1476, 1440, 1425, 1411, 1387, 1364, 1345, 1332, 1309 1290, 1266, 1240, 1213, 1190, 1173 1157 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₂ N ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 63.30; H, 5.56; N, 7.03; S, 8.05 実測値 (%): C, 63.16; H, 5.48; N, 6.95 S, 7.83
lh-23	mp 182-188°C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.68-1.89 (m, 4H), 2.40 (s, 3H), 2.45-2.64 (m, 4H), 3.14 (s, 3H), 4.86 (s, 2H), 6.66 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.43 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 12.97 (br s, 1H); IR (Nujol) 2655, 2553, 1712, 1619, 1597, 1477, 1407, 1383, 1365, 1343, 1306, 1290, 1267, 1243, 1213, 1185, 1168, 1148, 1121, 1110 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₄ N ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 64.06; H, 5.86; N, 6.79; S, 7.77 実測値 (%): C, 64.14; H, 5.84; N, 6.73; S, 7.61

(表 7 0)

化合物 番号	物性値
lh-24	Mp 240-250°C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.71-1.90 (m, 4H), 2.54-2.66 (m, 4H), 3.25 (s, 3H), 4.47 (s, 2H), 4.88 (s, 2H), 6.99 (dd, $J = 1.8, 8.4$ Hz, 1H), 7.18 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.31 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.34-7.42 (m, 5H), 12.99 (br s, 1H); IR (Nujol) 2657, 2557, 1710, 1620, 1603, 1582, 1496, 1479, 1456, 1440, 1412, 1383, 1340, 1311, 1289, 1269, 1250, 1217, 1190, 1173, 1160, 1140 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{24}\text{N}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.2\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 63.67; H, 6.00; N, 6.51; S, 7.45 実測値 (%): C, 63.75; H, 5.96; N, 6.51; S, 7.38
lh-25	mp 218-226°C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.68-1.90 (m, 4H), 2.50-2.65 (m, 4H), 3.25 (s, 3H), 4.86 (s, 2H), 7.02 (dd, $J = 1.8, 8.4$ Hz, 1H), 7.24 (d, $J = 15.3$ Hz, 1H), 7.29-7.47 (m, 5H), 7.37 (d, $J = 15.3$ Hz, 1H), 7.69-7.77 (m, 2H), 12.95 (br s, 1H); IR (Nujol) 3057, 2662, 2568, 1721, 1616, 1578, 1478, 1451, 1410, 1385, 1338, 1307, 1290, 1253, 1212, 1179, 1166, 1154, 1133 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{24}\text{N}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.2\text{AcOEt}$) 計算値 (%): C, 64.65; H, 5.84; N, 6.34; S, 7.25 実測値 (%): C, 6.45; H, 5.80; N, 6.36; S, 7.26
lh-26	mp 114-118 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.70-1.90 (m, 4H), 2.44-2.66 (m, 4H), 3.10 (s, 3H), 4.84 (s, 2H), 6.68 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 6.87 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 6.97 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.24 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.34 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 12.99 (br, 1H); IR (Nujol) 3376, 2924, 1728, 1586, 1499, 1376, 1329, 1283, 1226, 1147 cm^{-1}
lh-27	mp 165-168 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 0.97 (s, 6H), 1.52-1.62 (m, 2H), 2.31 (s, 2H), 2.50-2.60 (m, 2H), 4.80 (s, 2H), 6.71 (dd, $J = 1.8, 8.7$ Hz, 1H), 7.00 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.25 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.30-7.39 (m, 2H), 7.68-7.76 (m, 2H), 9.82 (br s, 1H), 12.91 (br, 1H); IR (Nujol) 3252, 2925, 1752, 1590, 1467, 1291, 1233, 1146 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{23}\text{N}_2\text{FO}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 61.38; H, 5.39; F, 4.41; N, 6.51; S, 7.49 実測値 (%): C, 61.42; H, 5.57; F, 4.20; N, 6.70; S, 7.17
lh-28	mp 122-125 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 0.98 (s, 6H), 1.54-1.64 (m, 2H), 2.33 (s, 2H), 2.52-2.60 (m, 2H), 4.82 (s, 2H), 6.77 (dd, $J = 1.8, 8.7$ Hz, 1H), 7.04-7.10 (m, 2H), 7.21 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.40 (dd, $J = 1.5, 3.6$ Hz, 1H), 7.82 (dd, $J = 1.5, 4.8$ Hz, 1H), 9.93 (br s, 1H), 12.90 (br, 1H); IR (Nujol) 3250, 3112, 2923, 2666, 1709, 1474, 1411, 1251, 1159 cm^{-1}
lh-29	mp 155-160°C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.72-1.93 (m, 4H), 2.54-2.66 (m, 4H), 4.30 (s, 2H), 4.86 (s, 2H), 6.96 (dd, $J = 2.1, 9.0$ Hz, 1H), 7.22 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.25-7.40 (m, 6H), 9.40 (s, 1H), 12.95 (br s, 1H); IR (Nujol) 3568, 3438, 3349, 3195, 3060, 2728, 2537, 1728, 1713, 1625, 1583, 1469, 1456, 1438, 1427, 1411, 1378, 1350, 1318, 1279, 1257, 1243, 1217, 1192, 1172, 1146, 1130 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{22}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 63.30; H, 5.56; N, 7.03; S, 8.05 実測値 (%): C, 63.00; H, 5.75; N, 6.91; S, 7.88

(表 7 1)

化合物 番号	物性値
lh-30	Mp 208-213°C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.68-1.88 (m, 4H), 2.50-2.62 (m, 4H), 4.80 (s, 2H), 6.92 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 15.3 Hz, 1H), 7.20 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.27 (d, J = 15.3 Hz, 1H), 7.33-7.42 (m, 3H), 7.58-7.66 (m, 2H), 9.53 (s, 1H), 12.92 (brs, 1H); IR (Nujol) 3279, 3259, 3241, 3044, 3023, 2652, 2550, 2362, 1729, 1713, 1618, 1589, 1576, 1490, 1469, 1449, 1430, 1412, 1403, 1384, 1351, 1318, 1308, 1275, 1260, 1237, 1214, 1198, 1175, 1136 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₂ N ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 64.37; H, 5.40; N, 6.82; S, 7.81 実測値 (%): C, 64.28; H, 5.50; N, 6.78; S, 7.56
lh-31	mp 112-115 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.99 (s, 6H), 1.54-1.66 (m, 2H), 2.34 (s, 2H), 2.56-2.66 (m, 2H), 3.16 (s, 3H), 4.87 (s, 2H), 6.67 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.36-7.46 (m, 2H), 7.57-7.66 (m, 2H), 12.95 (br, 1H); IR (Nujol) 2915, 1725, 1709, 1475, 1345, 1308, 1291, 1239, 1166 cm ⁻¹ .
lh-32	mp 180-184 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.99 (s, 6H), 1.56-1.64 (m, 2H), 2.33 (s, 2H), 2.54-2.66 (m, 2H), 3.21 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 4.87 (s, 2H), 6.67 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.97 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.26 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 12.97 (br, 1H); IR (Nujol) 3084, 2923, 2675, 2563, 1734, 1712, 1584, 1474, 1347, 1253, 1159 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₈ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 63.14; H, 6.18; N, 6.14; S, 7.05 実測値 (%): C, 62.92; H, 5.98; N, 6.09; S, 6.76
lh-33	mp 174-180 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.99 (s, 6H), 1.57-1.65 (m, 2H), 2.35 (s, 2H), 2.54-2.65 (m, 2H), 3.20 (s, 3H), 4.87 (s, 2H), 6.71 (dd, J = 2.1, 9.0 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.21-7.32 (m, 2H), 7.45 (dd, J = 1.5, 3.6 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 1.2, 2.1 Hz, 1H), 12.98 (br, 1H); IR (Nujol) 2923, 2745, 2657, 2560, 1731, 1597, 1579, 1474, 1335, 1308, 1265, 1240, 1147 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₄ N ₂ O ₄ S ₂ ·0.2AcOEt) 計算値 (%): C, 58.31; H, 5.59; N, 6.48; S, 14.83 実測値 (%): C, 58.16; H, 5.73; N, 6.22; S, 14.25
lh-34	mp 146-149 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.90-2.18 (m, 2H), 2.57-3.02 (m, 5H), 4.84 (s, 2H), 6.75 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.22-7.39 (m, 8H), 7.69-7.73 (m, 2H), 9.84 (s, 1H), 13.00 (br, 1H); IR (Nujol) 3208, 2925, 2854, 1729, 1592, 1495, 1286, 1240, 1197, 1156, 1146 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₆ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 64.53; H, 4.92; F, 3.93; N, 5.79; S, 6.63 実測値 (%): C, 64.52; H, 4.55; F, 3.82; N, 5.75; S, 6.48
lh-35	mp 152-155 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.90-2.19 (m, 2H), 2.53-3.02 (m, 5H), 3.76 (s, 3H), 4.83 (s, 2H), 6.76 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.98-7.38 (m, 9H), 7.59-7.62 (m, 2H), 9.66 (s, 1H), 13.00 (br, 1H); IR (Nujol) 3305, 2924, 2853, 1716, 1594, 1474, 1258, 1152 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₇ H ₂₆ N ₂ O ₅ S·0.3H ₂ O) 計算値 (%): C, 65.53; H, 5.41; N, 5.65; S, 6.47 実測値 (%): C, 65.53; H, 5.28; N, 5.38; S, 6.12

(表 7 2)

化合物 番号	物性値
lh-36	mp 204-206 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.95-2.18 (m, 2H), 2.54-3.02 (m, 5H), 3.16 (s, 3H), 4.90 (s, 2H), 6.72 (dd, J = 2.1, 9.0 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.20-7.61 (m, 10H); IR (Nujol) 2925, 2854, 1726, 1589, 1476, 1346, 1336, 1254, 1224, 1148 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₇ H ₂₅ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 65.84; H, 5.12; F, 3.86; N, 5.69; S, 6.513 実測値 (%): C, 65.542; H, 4.94; F, 3.87; N, 5.61; S, 6.48
lh-37	mp 121-124 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.94-2.19 (m, 2H), 2.52-3.03 (m, 5H), 3.12 (s, 3H), 3.81 (s, 3H), 4.89 (s, 2H), 6.72 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 6.99 (s, 1H), 7.06-7.09 (m, 2H), 7.20-7.47 (m, 8H); IR (Nujol) 2924, 2853, 1741, 1689, 1596, 1480, 1458, 1340, 1259, 1197, 1180, 1162, 1150 cm ⁻¹
lh-38	mp 168-172 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.81 (t, J = 7.8 Hz, 6H), 1.21-1.40 (m, 4H), 1.60 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.28 (s, 2H), 2.50 (m, 2H), 3.76 (s, 3H), 4.78 (s, 2H), 6.73 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.97-7.03 (m, 3H), 7.15 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.57-7.62 (m, 2H), 9.62 (s, 1H), 12.95 (br, 1H); IR (Nujol) 3303, 2924, 2853, 1719, 1598, 1498, 1486, 1469, 1404, 1254, 1155 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₅ H ₃₀ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 63.81; H, 6.43; N, 5.95; S, 6.65 実測値 (%): C, 63.54; H, 6.31; N, 5.90; S, 6.65
lh-39	mp 188-197 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.68-1.88 (m, 4H), 2.46-2.62 (m, 4H), 4.79 (s, 2H), 6.71 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.18 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.66 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 9.87 (s, 1H), 12.90 (brs, 1H); IR (Nujol) 3208, 3084, 1755, 1736, 1581, 1474, 1419, 1404, 1381, 1365, 1348, 1333, 1384, 1322, 1304, 1279, 1261, 1198, 1154 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₁₉ ClN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 57.34; H, 4.57; Cl, 8.46; N, 6.69; S, 7.65 実測値 (%): C, 57.28; H, 4.75; Cl, 7.94; N, 6.86; S, 7.39
lh-40	mp 170-175 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.68-1.87 (m, 4H), 2.43-2.60 (m, 4H), 4.79 (s, 2H), 6.73 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.87 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 10.03 (s, 1H), 12.91 (brs, 1H); IR (Nujol) 3216, 3046, 1754, 1738, 1605, 1593, 1472, 1423, 1405, 1380, 1366, 1340, 1325, 1306, 1294, 1282, 1265, 1216, 1194, 1173, 1154, 1110 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₁₉ F ₃ N ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 55.75; H, 4.23; F, 12.60; N, 6.19; S, 7.09 実測値 (%): C, 55.94; H, 4.46; F, 12.31; N, 6.46; S, 6.94
lh-41	mp 162-165 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.68-1.89 (m, 4H), 2.46-2.65 (m, 4H), 3.17 (s, 3H), 4.86 (s, 2H), 6.68 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.66 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 12.90 (brs, 1H); IR (Nujol) 3095, 2743, 2656, 2556, 1729, 1711, 1584, 1476, 1444, 1427, 1411, 1385, 1346, 1310, 1280, 1267, 1242, 1213, 1189, 1173, 1156 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₁ ClN ₂ O ₄ S·0.05AcOEt) 計算値 (%): C, 58.22; H, 4.93; Cl, 8.11; N, 6.41; S, 7.33 実測値 (%): C, 58.32; H, 4.94; Cl, 7.85; N, 6.68; S, 7.30

(表 7 3)

化合物 番号	物性値
lh-42	mp 181-188°C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.68-1.88 (m, 4H), 2.44-2.64 (m, 4H), 3.21 (s, 3H), 4.87 (s, 2H), 6.70 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.97 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 12.99 (brs, 1H); IR (Nujol) 3111, 3085, 3053, 2739, 2653, 2552, 1733, 1712, 1609, 1582, 1477, 1447, 1426, 1408, 1386, 1366, 1348, 1327, 1311, 1281, 1267, 1239, 1214, 1191, 1174, 1158, 1128, 1110 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₁ F ₃ N ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 56.65; H, 4.54; F, 12.22; N, 6.01; S, 6.87 実測値 (%): C, 56.77; H, 4.62; F, 11.93; N, 6.30; S, 6.88
lh-43	mp 227-232°C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.68-1.88 (m, 4H), 2.46-2.64 (m, 4H), 3.18 (s, 3H), 4.86 (s, 2H), 6.71 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.98 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.11 (dd, J = 1.5, 5.1 Hz, 1H), 7.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.77 (dd, J = 3.0, 5.1 Hz, 1H), 8.03 (dd, J = 1.5, 3.0 Hz, 1H), 12.99 (brs, 1H); IR (Nujol) 3120, 3086, 2742, 2651, 2552, 2455, 1721, 1615, 1577, 1499, 1475, 1439, 1425, 1410, 1386, 1362, 1342, 1309, 1267, 1240, 1209, 1190, 1174, 1152, 1101 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₉ H ₂₀ N ₂ O ₄ S ₂) 計算値 (%): C, 56.42 H, 4.98; N, 6.93; S, 15.85 実測値 (%): C, 56.15; H, 4.93; N, 6.87; S, 15.71
lh-44	mp 164-168°C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.68-1.88 (m, 4H), 2.44-2.64 (m, 4H), 3.21 (s, 3H), 4.87 (s, 2H), 6.70 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.97 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 12.99 (brs, 1H); IR (Nujol) 3016, 2745, 2658, 2560, 1721, 1591, 1581, 1477, 1446, 1427, 1414, 1389, 1351, 1334, 1310, 1293, 1264, 1246, 1212, 1190, 1162, 1102 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₁ F ₃ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 54.77; H, 4.39; F, 11.81; N, 5.81; S, 6.65 実測値 (%): C, 54.69; H, 4.28; F, 11.56; N, 5.82; S, 6.59
lh-45	mp 97-100 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.82 (t, J = 7.5 Hz, 6H), 1.21-1.40 (m, 4H), 1.63 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.31 (s, 2H), 2.55 (br t, 2H), 3.17 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.68 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.98 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.38-7.62 (m, 4H); IR (Nujol) 2956, 2854, 1738, 1699, 1591, 1495, 1475, 1331, 1236, 1196, 1151 cm ⁻¹ .
lh-46	mp 103-105 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.82 (t, J = 7.2 Hz, 6H), 1.20-1.40 (m, 4H), 1.63 (br t, 2H), 2.30 (s, 2H), 2.55 (br t, 2H), 3.13 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.68 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.95 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.07-7.10 (m, 2H), 7.24 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.44-7.48 (m, 2H); IR (Nujol) 2925, 2854, 1758, 1739, 1683, 1599, 1474, 1338, 1264, 1182, 1164, 1153 cm ⁻¹ .
lh-47	Mp 160-163 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.24-1.57 (m, 10H), 1.66 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.36 (s, 2H), 2.53 (br t, 2H), 4.78 (s, 2H), 6.71 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.31-7.37 (m, 2H), 7.70-7.75 (m, 2H), 9.79 (s, 1H), 12.9 (br, 1H); IR (Nujol) 3297, 3278, 2919, 2854, 1746, 1720, 1590, 1468, 1251, 1162, 1151 cm ⁻¹ .

(表 7 4)

化合物 番号	物性値
lh-48	mp 201-204 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.24-1.59 (m, 10H), 1.66 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.36 (s, 2H), 2.53 (br t, 2H), 3.77 (s, 3H), 4.78 (s, 2H), 6.73 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 6.99-7.16 (m, 3H), 7.15 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.59-7.63 (m, 2H), 9.62 (s, 1H), 12.5 (br, 1H); IR (Nujol) 3249, 2924, 2853, 1737, 1595, 1470, 1329, 1262, 1154 cm ⁻¹ .
lh-49	mp 198-205 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.68-1.86 (m, 4H), 2.46-2.60 (m, 4H), 4.80 (s, 2H), 6.76 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.18 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 1.5, 5.1 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 3.0, 5.1 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 1.5, 3.0 Hz, 1H), 9.71 (s, 1H), 12.93 (brs, 1H); IR (Nujol) 3205, 3103, 1735, 1478, 1459, 1435, 1401, 1365, 1349, 1333, 1312, 1281, 1264, 1206, 1146 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₈ H ₁₈ N ₂ O ₄ S ₂) 計算値 (%): C, 55.37; H, 4.65; N, 7.17; S, 16.42 実測値 (%): C, 55.22; H, 4.56; N, 7.04; S, 16.15
lh-50	mp 177-181 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.91 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.30-1.50 (m, 6H), 1.90-2.16 (m, 2H), 2.46-2.70 (m, 3H), 4.77 (s, 2H), 6.71 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.30-7.38 (m, 2H), 7.67-7.75 (m, 2H), 9.81 (br s, 1H); IR (Nujol) 3294, 3102, 3069, 3032, 2919, 2667, 2573, 1722, 1590, 1470, 1403, 1341, 1293, 1254 cm ⁻¹
lh-51	mp 112-115 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.96 (s, 9H), 1.21-1.48 (m, 2H), 2.02-2.30 (m, 2H), 2.42-2.78 (m, 3H), 4.77 (s, 2H), 6.70 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.30-7.40 (m, 2H), 7.68-7.77 (m, 2H), 9.80 (br s, 1H); IR (Nujol) 3249, 2923, 2662, 1711, 1591, 1495, 1477, 1414, 1339, 1295, 1241, 1194, 1156 cm ⁻¹ .
lh-52	mp 168-171 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.92 (t, J = 6.6 Hz, 3H), 1.32-1.52 (m, 6H), 1.90-2.16 (m, 2H), 2.46-2.76 (m, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.74 (s, 2H), 6.72 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.96-7.06 (m, 3H), 7.13 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 9.61 (s, 1H); IR (Nujol) 3302, 3017, 2923, 2669, 2563, 1720, 1594, 1471, 1402, 1336, 1253, 1193 cm ⁻¹
lh-53	mp 179-181 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.96 (s, 9H), 1.21-1.50 (m, 2H), 2.00-2.30 (m, 2H), 2.40-2.78 (m, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.77 (s, 2H), 6.72 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 6.96-7.08 (m, 3H), 7.12 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 9.61 (br s, 1H); IR (Nujol) 3665, 3297, 2923, 2666, 2570, 1718, 1594, 1470, 1403, 1254, 1194 cm ⁻¹ .
lh-54	mp 151-158 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.67-1.86 (m, 4H), 2.44-2.61 (m, 4H), 4.79 (s, 2H), 6.73 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.98 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.19 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.78 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 9.89 (s, 1H), 12.93 (brs, 1H); IR (Nujol) 3287, 3104, 3038, 1720, 1592, 1487, 1473, 1411, 1399, 1376, 1366, 1355, 1336, 1292, 1247, 1209, 1170, 1152 cm ⁻¹ .

(表 7 5)

化合物 番号	物性値
lh-55	mp 155-158 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.23-1.53 (m, 10H), 1.68 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.39 (s, 2H), 2.56 (br t, 2H), 3.17 (s, 3H), 4.86 (s, 2H), 6.68 (dd, J = 2.1, 9.0 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.26 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.38-7.63 (m, 4H); IR (Nujol) 2917, 2854, 1725, 1590, 1478, 1342, 1233, 1146 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₆ H ₂₉ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 64.44; H, 6.03; F, 3.92; N, 5.78; S, 6.62 実測値 (%): C, 64.12; H, 6.16; F, 3.59; N, 5.52; S, 6.18
lh-56	mp 132-135 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.22-1.54(m, 10H), 1.66 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.38 (s, 2H), 2.56 (br t, 2H), 3.13 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.68 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.98 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.07-7.11 (m, 2H), 7.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.45-7.49 (m, 2H); IR (Nujol) 2917, 2854, 1725, 1597, 1496, 1477, 1338, 1255, 1236, 1148 cm ⁻¹
lh-57	mp 161-163 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.92 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.22-1.50 (m, 5H), 1.62-1.78 (m, 1H), 1.90-2.18 (m, 2H), 2.46-2.74 (m, 3H), 3.17 (s, 3H), 4.84 (s, 2H), 6.69 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.38-7.48 (m, 2H), 7.56-7.64 (m, 2H); IR (Nujol) 2924, 2746, 2657, 2561, 1716, 1591, 1476, 1347, 1307, 1289, 1242, 1148 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₇ N ₂ FO ₄ S) 計算値 (%): C, 62.86; H, 5.93; F, 4.14; N, 6.11; S, 6.99 実測値 (%): C, 62.92; H, 6.09; F, 3.93; N, 6.20; S, 6.69
lh-58	mp 162-164 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.97 (s, 9H), 1.28-1.58 (m, 2H), 2.02-2.30 (m, 2H), 2.42-2.80 (m, 3H), 3.17 (s, 3H), 4.84 (s, 2H), 6.67 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.36-7.46 (m, 2H), 7.56-7.64 (m, 2H), 12.98 (br, 1H); IR (Nujol) 3100, 3080, 3049, 2924, 2743, 2633, 1590, 1437, 1412, 1344, 1235, 1169, 1145 cm ⁻¹
lh-59	mp 152-155 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.92 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.30-1.54 (m, 6H), 1.90-2.16 (m, 2H), 2.46-2.76 (m, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.68 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.97 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.45 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 13.00 (br s, 1H); IR (Nujol) 2952, 2752, 2665, 2569, 1729, 1598, 1576, 1499, 1476, 1345, 1308, 1246, 1153cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₅ H ₃₀ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 63.81; H, 6.43; N, 5.95; S, 6.81 実測値 (%): C, 63.72; H, 6.38; N, 6.00; S, 6.68
lh-60	mp 140-144°C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.97(s, 9H), 1.24-1.50 (m, 2H), 2.00-2.30 (m, 2H), 2.40-2.78 (m, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 4.84 (s, 2H), 6.68 (dd, J = 2.1, 8.4 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.22 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 13.00 (br, 1H); IR (Nujol) 2924, 2746, 2641, 2559, 1717, 1596, 1578, 1476, 1341, 1241, cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₆ H ₃₂ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 64.44; H, 6.66; N, 5.78; S, 6.66 実測値 (%): C, 64.23; H, 6.78; N, 5.90; S, 6.36

(表 7 6)

化合物 番号	物性値
lh-61	mp 169-171 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.89 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.20-2.19 (m, 12H), 2.57-2.76 (m, 3H), 3.17 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.70 (dd, J = 2.1, 8.4 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.26 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.38-7.46 (m, 2H), 7.57-7.62 (m, 2H), 13.00 (br s, 1H); IR (Nujol) 2920, 2854, 1720, 1591, 1476, 1346, 1240, 1146 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₆ H ₃₁ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 64.18; H, 6.42; F, 3.90; N, 5.76; S, 6.59 実測値 (%): C, 64.20; H, 6.46; F, 3.66; N, 5.80; S, 6.52
lh-62	mp 157-160 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.89 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.26-2.19 (m, 12H), 2.54-2.76 (m, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.69 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.98 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.06-7.12 (m, 2H), 7.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.43-7.48 (m, 2H), 13.00 (br s, 1H); IR (Nujol) 2924, 2854, 1721, 1597, 1496, 1476, 1338, 1256, 1242, 1149 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₇ H ₃₄ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 65.04; H, 6.87; N, 5.62; S, 6.43 実測値 (%): C, 64.92; H, 6.88; N, 5.62; S, 6.42
lh-63	mp 183-189 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.74-1.84 (m, 4H), 2.51-2.60 (m, 4H), 3.55 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.84 (s, 3H), 4.86 (s, 2H), 6.62 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.95 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.06-7.11 (m, 2H), 7.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.49-7.54 (m, 2H), 13.04 (br, 1H); IR (Nujol) 3201, 3114, 1767, 1748, 1593, 1579, 1493, 1477, 1458, 1427, 1377, 1324, 1308, 1257, 1189, 1154, 1084, 1065, 1057 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₈ H ₂₆ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 62.42; H, 5.92; N, 6.33; S, 7.25 実測値 (%): C, 62.36; H, 5.91; N, 6.32; S, 7.07
lh-64	mp 146-150 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.84 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.25-1.36 (m, 2H), 1.70-1.88 (m, 4H), 2.50-2.61 (m, 4H), 3.44 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 3.84 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.62 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.94 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.06-7.11 (m, 2H), 7.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.47-7.52 (m, 2H), 12.92 (br, 1H); IR (Nujol) 2744, 2654, 2557, 1741, 1720, 1596, 1580, 1494, 1475, 1440, 1414, 1375, 1342, 1306, 1255, 1240, 1176, 1166, 1148, 1107, 1092, 1072, 1058, 1033 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₈ N ₂ O ₅ S·0.4AcOEt) 計算値 (%): C, 62.52; H, 6.39; N, 5.70; S, 6.52 実測値 (%): C, 62.58; H, 6.44; N, 5.76; S, 6.30
lh-65	mp 200-210 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.86 (d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.41 (m, 1H), 1.70-1.88 (m, 4H), 2.50-2.64 (m, 4H), 3.32 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 3.84 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.64 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.95 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.05-7.10 (m, 2H), 7.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.45-7.50 (m, 2H); IR (Nujol) 3150, 2575, 2421, 1738, 1715, 1621, 1596, 1579, 1497, 1476, 1467, 1426, 1376, 1366, 1320, 1307, 1265, 1211, 1180, 1146, 1090, 1069, 1055 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₅ H ₃₀ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 63.81; H, 6.43; N, 5.95; S, 6.81 実測値 (%): C, 63.72; H, 6.32; N, 5.89; S, 6.55

(表 7 7)

化合物 番号	物性値
lh-66	mp 184-193 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 0.97 (d, $J = 6.9$ Hz, 6H), 1.72-1.89 (m, 4H), 2.51-2.65 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 4.47 (m, 1H), 4.87 (s, 2H), 6.63 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 6.95 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.08-7.13 (m, 2H), 7.29 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.62-7.67 (m, 2H); IR (Nujol) 3261, 1750, 1713, 1596, 1577, 1498, 1476, 1378, 1364, 1338, 1318, 1303, 1265, 1217, 1183, 1146, 1112, 1086 cm^{-1} .
lh-67	mp 183-186 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 0.97 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.70-1.90 (m, 4H), 2.53-2.64 (m, 4H), 3.60 (q, $J = 7.2$ Hz, 2H), 4.86 (s, 2H), 6.63 (dd, $J = 1.8, 8.7$ Hz, 1H), 6.95 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.28 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.38-7.45 (m, 2H), 7.62-7.68 (m, 2H); IR (Nujol) 2925, 2854, 1725, 1711, 1592, 1476, 1341, 1243, 1182, 1172, 1148 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{23}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 61.38; H, 5.39; F, 4.41; N, 6.51; S, 7.45 実測値 (%): C, 61.12; H, 5.55; F, 4.14; N, 6.33; S, 7.08
lh-68	mp 182-184 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 0.85 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.24-1.41 (m, 2H), 1.70-1.90 (m, 4H), 2.52-2.64 (m, 4H), 3.51 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 4.86 (s, 2H), 6.64 (dd, $J = 1.8, 8.7$ Hz, 1H), 6.95 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.27 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.38-7.45 (m, 2H), 7.62-7.66 (m, 2H); IR (Nujol) 2925, 2854, 1727, 1709, 1592, 1492, 1475, 1341, 1291, 1241, 1172, 1146 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{25}\text{N}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 62.14; H, 5.67; F, 4.27; N, 6.30; S, 7.21 実測値 (%): C, 61.94; H, 5.70; F, 4.07; N, 6.32; S, 6.96
lh-69	mp 165-168 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.70-1.90 (m, 4H), 2.52-2.64 (m, 4H), 4.22 (d, $J = 5.7$ Hz, 2H), 4.85 (s, 2H), 4.99-5.13 (m, 2H), 5.62-5.80 (m, 1H), 6.66 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 6.97 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.24 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.39-7.46 (m, 2H), 7.64-7.69 (m, 2H); IR (Nujol) 2925, 2853, 1727, 1709, 1592, 1493, 1477, 1344, 1243, 1166, 1154 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{23}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 62.43; H, 5.24; F, 4.29; N, 6.30; S, 7.25 実測値 (%): C, 62.22; H, 5.27; F, 4.12; N, 6.32; S, 6.99
lh-70	mp 199-204 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.70-1.90 (m, 4H), 2.52-2.64 (m, 4H), 3.20 (br t, 1H), 4.49 (d, $J = 2.4$ Hz, 2H), 4.87 (s, 2H), 6.77 (dd, $J = 1.8, 8.4$ Hz, 1H), 7.08 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.29 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.39-7.46 (m, 2H), 7.68-7.73 (m, 2H); IR (Nujol) 3292, 2925, 2854, 1724, 1592, 1477, 1337, 1238, 1155 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{21}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 62.71; H, 4.81; F, 4.31; N, 6.36; S, 7.28 実測値 (%): C, 62.55; H, 4.91; F, 4.10; N, 6.32; S, 7.21
lh-71	mp 164-167 °C; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.70-1.90 (m, 4H), 2.52-2.64 (m, 4H), 4.55 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 4.86 (s, 2H), 6.70 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 7.00 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.29 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.38-7.45 (m, 2H), 7.67-7.73 (m, 2H); IR (Nujol) 2920, 2854, 1724, 1710, 1593, 1495, 1478, 1344, 1240, 1167, 1155 cm^{-1} .

(表 7 8)

化合物 番号	物性値
lh-72	mp 143-147 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.70-1.90 (m, 4H), 2.52-2.64 (m, 4H), 3.33-3.50 (m, 2H), 3.61 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 4.73 (br s, 1H), 4.86 (s, 2H), 6.65 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.38-7.45 (m, 2H), 7.63-7.69 (m, 2H); IR (Nujol) 3610, 3439, 2925, 2854, 1724, 1710, 1591, 1493, 1476, 1341, 1238, 1166, 1153 cm ⁻¹
lh-73	mp 184-189 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.05-0.10 (m, 2H), 0.31-0.37 (m, 2H), 1.70-1.91 (m, 4H), 2.52-2.60 (m, 4H), 3.45 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 4.86 (s, 2H), 6.68 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.37-7.44 (m, 2H), 7.62-7.68 (m, 2H); IR (Nujol) 2923, 2854, 1725, 1712, 1592, 1492, 1470, 1343, 1241, 1164, 1151 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₅ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 63.14; H, 5.52; F, 4.16; N, 6.14; S, 7.02 実測値 (%): C, 63.05; H, 5.54; F, 3.95; N, 6.13; S, 6.88
lh-74	mp 139-144 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.70-1.88 (m, 4H), 2.49-2.63 (m, 4H), 3.84 (s, 3H), 4.18 (d, 6.3 Hz, 2H), 4.84 (s, 2H), 4.98 (dd, J = 1.5, 10.2 Hz, 2H), 5.08 (dd, J = 1.5, 17.1 Hz, 1H), 5.70 (m, 1H), 6.63 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.96 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.06-7.11(m, 2H), 7.23 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.50-7.55 (m, 2H), 13.00 (br, 1H); IR (Nujol) 2753, 2651, 2570, 1719, 1597, 1578, 1496, 1477, 1464, 1444, 1417, 1377, 1341, 1308, 1252, 1179, 1155, 1092, 1060, 1022 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₆ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 63.42; H, 5.77; N, 6.16; S, 7.05 実測値 (%): C, 63.26; H, 5.54; N, 6.19; S, 6.82
lh-75	mp 134-138 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.44 (s, 3H), 1.54 (s, 3H), 1.70-1.86 (m, 4H), 2.49-2.63 (m, 4H), 3.84 (s, 3H), 4.31 (d, 6.9 Hz, 2H), 4.85 (s, 2H), 5.04 (m, 1H), 6.64 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.94 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.06-7.11(m, 2H), 7.23 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.49-7.54 (m, 2H), 13.00 (br, 1H); IR (Nujol) 2742, 2655, 2558, 1721, 1596, 1580, 1496, 1476, 1465, 1441, 1413, 1388, 1376, 1364, 1338, 1306, 1256, 1242, 1213, 1177, 1155, 1112, 1094, 1080, 1036 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₆ H ₃₀ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 64.71; H, 6.27; N, 5.80; S, 6.64 実測値 (%): C, 64.68; H, 6.04; N, 5.82; S, 6.36
lh-76	mp 193-202 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.72-1.88 (m, 4H), 2.49-2.64 (m, 4H), 3.16 (t, J = 2.4 Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 4.44 (d, 2.4 Hz, 2H), 4.86 (s, 2H), 6.74 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.05-7.10(m, 2H), 7.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.53-7.58 (m, 2H), 13.02 (br, 1H); IR (Nujol) 3281, 3030, 2746, 2657, 2562, 1721, 1597, 1580, 1499, 1477, 1462, 1438, 1426, 1413, 1388, 1329, 1306, 1265, 1245, 1154, 1098, 1034 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₄ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 63.70; H, 5.35; N, 6.19; S, 7.09 実測値 (%): C, 63.61; H, 5.36; N, 6.29; S, 6.89

(表 7 9)

化合物 番号	物性値
lh-77	mp 176-189 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.02-0.08 (m, 2H), 0.30-0.36 (m, 2H), 0.77 (m, 1H), 1.70-1.88 (m, 4H), 2.49-2.64 (m, 4H), 3.41 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 3.84 (s, 3H), 4.86 (s, 2H), 6.67 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.05-7.10 (m, 2H), 7.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.49-7.54 (m, 2H), 12.96 (br, 1H); IR (Nujol) 3146, 1739, 1594, 1579, 1496, 1477, 1442, 1426, 1397, 1377, 1339, 1319, 1303, 1263, 1216, 1187, 1146, 1089, 1065, 1047 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₅ H ₂₈ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 64.08; H, 6.02; N, 5.98; S, 6.84 実測値 (%): C, 63.97; H, 6.09; N, 6.05; S, 6.63
lh-78	mp 167-177 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.72-1.89 (m, 4H), 2.49-2.65 (m, 4H), 3.34 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.56 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.84 (s, 3H), 4.68 (br, 1H), 4.85 (s, 2H), 6.64 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.98 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.06-7.11 (m, 2H), 7.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.50-7.54 (m, 2H), 12.96 (br, 1H); IR (Nujol) 3554, 3230, 1770, 1747, 1593, 1578, 1495, 1478, 1458, 1396, 1377, 1325, 1301, 1261, 1221, 1185, 1156, 1088, 1060 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₃ H ₂₆ N ₂ O ₆ S) 計算値 (%): C, 60.25; H, 5.72; N, 6.11; S, 6.99 実測値 (%): C, 60.09; H, 5.60; N, 6.07; S, 6.87
lh-79	mp 185-197 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.85-1.25 (m, 6H), 1.52-1.90 (m, 9H), 2.49-2.63 (m, 4H), 3.38 (d, J = 7.2 Hz, 2H), 4.86 (s, 2H), 6.66 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.36-7.43 (m, 2H), 7.57-7.63 (m, 2H), 12.99 (br, 1H); IR (Nujol) 3110, 3052, 2735, 2656, 2548, 1734, 1710, 1593, 1492, 1472, 1423, 1407, 1384, 1343, 1289, 1234, 1169, 1153, 1099, 1091, 1063 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₇ H ₃₁ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 65.04; H, 6.27; F, 3.81; N, 5.62; S, 6.43 実測値 (%): C, 64.81; H, 6.26; F, 3.69; N, 5.58; S, 6.32
lh-80	mp 197-207 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.84-1.20 (m, 6H), 1.52-1.88 (m, 9H), 2.49-2.63 (m, 4H), 3.34 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.65 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.04-7.09 (m, 2H), 7.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.44-7.50 (m, 2H), 13.03 (br, 1H); IR (Nujol) 3159, 1740, 1580, 1499, 1475, 1445, 1387, 1376, 1365, 1349, 1321, 1306, 1265, 1198, 1161, 1142, 1091 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₈ H ₃₄ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 65.86; H, 6.71; N, 5.49; S, 6.28 実測値 (%): C, 65.79; H, 6.74; N, 5.52; S, 6.24
lh-81	mp 177-180 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.70-1.88 (m, 4H), 2.49-2.63 (m, 4H), 3.82 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 5.02 (s, 2H), 6.70 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.35-7.43 (m, 2H), 7.68-7.75 (m, 2H), 12.99 (br, 1H); IR (Nujol) 3059, 3012, 2741, 2654, 2550, 1726, 1707, 1593, 1496, 1478, 1444, 1426, 1410, 1387, 1338, 1296, 1235, 1213, 1179, 1156, 1110, 1099, 1082, 1033 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₃ FN ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 59.18; H, 5.19; F, 4.26; N, 6.27; S, 7.18 実測値 (%): C, 59.08; H, 5.29; F, 4.05; N, 6.19; S, 6.96

(表 8 0)

化合物 番号	物性値
lh-82	mp 153-157 °C; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ 1.70-1.88 (m, 4H), 2.49-2.63 (m, 4H), 3.31 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 4.84 (s, 2H), 4.99 (s, 2H), 6.69 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 7.02 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.03-7.08 (m, 2H), 7.25 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.55-7.60 (m, 2H), 12.99 (br, 1H); IR (Nujol) 2747, 2656, 2561, 1726, 1597, 1579, 1498, 1476, 1442, 1414, 1386, 1338, 1307, 1260, 1242, 1178, 1157, 1140, 1113, 1097, 1066, 1037 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{23}\text{H}_{26}\text{N}_2\text{O}_6\text{S}$) 計算値 (%): C, 60.25; H, 5.72; N, 6.11; S, 6.99 実測値 (%): C, 60.14; H, 5.82; N, 6.09; S, 6.97
lh-83	mp 189-193 °C; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ 1.09 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H), 1.30-1.45 (m, 1H), 1.80-2.00 (m, 2H), 2.07-2.80 (m, 4H), 3.16 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.67 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 7.01 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.27 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.39-7.62 (m, 4H), 12.91 (br, 1H); IR (Nujol) 2923, 2854, 1730, 1592, 1476, 1346, 1237, 1150 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{23}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 61.38; H, 5.39; F, 4.41; N, 6.51; S, 7.45 実測値 (%): C, 61.34; H, 5.42; F, 4.21; N, 6.62; S, 7.30
lh-84	mp 157-161 °C; $^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ 1.09 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 1.30-1.45 (m, 1H), 1.80-2.00 (m, 2H), 2.10-2.80 (m, 4H), 3.12 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.67 (dd, $J = 2.1, 9.0$ Hz, 1H), 7.00 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.07-7.27 (m, 2H), 7.45 (d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.44-7.48 (m, 2H), 13.00 (br, 1H); IR (Nujol) 2924, 2853, 1724, 1595, 1475, 1341, 1248, 1151 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{23}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 62.42; H, 5.92; N, 6.33; S, 7.25 実測値 (%): C, 62.41; H, 5.93; N, 6.48; S, 7.19
li-1	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 5.17 (s, 2H), 7.07-7.45 (m, 7H), 7.58 (t, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.70 (m, 1H), 7.81-7.91 (m, 3H); IR (KBr) 3249, 1730, 1610, 1591, 1495, 1495, 1475, 1390, 1324, 1235, 1168, 1153, 1090, 1011 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{16}\text{FN}_3\text{O}_4\text{S} \cdot \text{MeOH}$) 計算値 (%): C, 57.76; H, 4.41; N, 9.19; F, 4.15; S, 7.01 実測値 (%): C, 57.72; H, 4.07; N, 8.80; F, 4.10; S, 7.06
li-2	$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3 + \text{CD}_3\text{OD}$) δ 4.87 (s, 2H), 6.99 (m, 1H), 7.08-7.42 (m, 9H), 7.73 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.82 (m, 2H); IR (KBr) 3254, 1726, 1607, 1590, 1550, 1494, 1468, 1406, 1378, 1335, 1293, 1238, 1166, 1153, 1089 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{22}\text{H}_{17}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 0.8\text{MeOH}$) 計算値 (%): C, 60.84; H, 4.52; N, 6.22; F, 4.22; S, 7.12 実測値 (%): C, 60.52; H, 4.13; N, 6.19; F, 3.85; S, 6.99
li-3	$^1\text{H-NMR}$ (CD_3OD) δ 3.33 (s, 3H), 5.08 (s, 2H), 7.02 (m, 1H), 7.17-7.51 (m, 8H), 7.64-7.76 (m, 4H); IR (CHCl_3) 3066, 2928, 1727, 1591, 1550, 1493, 1469, 1380, 1349, 1293, 1234, 1175, 1151, 1087 cm^{-1} .
lj-1	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.55-2.30 (m, 6H), 3.34 (m, 1H), 3.82 (m, 1H), 4.77 (br, 1H), 4.82 (s, 2H), 6.75-7.25 (m, 6H), 7.45-7.91 (m, 3H); IR (KBr) 3275, 2955, 1731, 1592, 1494, 1469, 1328, 1292, 1237, 1152, 1092, 1014 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{21}\text{H}_{21}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S} \cdot 1.1\text{H}_2\text{O}$) 計算値 (%): C, 57.57; H, 5.38; N, 6.39; F, 4.34; S, 7.32 実測値 (%): C, 57.73; H, 5.08; N, 6.11; F, 4.04; S, 6.87

(表 8 1)

化合物 番号	物性値
lj-2	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.59-2.18 (m, 6H), 2.70 (s, 3H), 3.25 (m, 1H), 4.56 (m, 1H), 4.83 (s, 2H), 6.80 (s, 1H), 7.07-7.22 (m, 6H), 7.51 (m, 1H), 7.75-7.87 (m, 2H); IR (KBr) 2952, 1729, 1591, 1493, 1469, 1335, 1292, 1233, 1152, 1087, 1013 cm^{-1} .
lj-3	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ 1.43-2.18 (s, 6H), 3.17 (s, 1H), 4.26-4.82 (m, 5H), 6.59-7.44 (m, 12H), 7.75-7.87 (m, 2H); IR (KBr) 3433, 2951, 1731, 1591, 1494, 1469, 1337, 1292, 1235, 1152, 1092 cm^{-1} .
lk-1	mp 165-179 $^{\circ}\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 2.09 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 3.17 (d, $J = 0.6$ Hz, 3H), 4.90 (s, 2H), 6.68 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 7.02 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.26 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.39-7.44 (m, 2H), 7.57-7.62 (m, 2H), 12.97 (br, 1H); IR (Nujol) 3211, 1766, 1739, 1590, 1492, 1481, 1461, 1418, 1377, 1326, 1291, 1264, 1238, 1177, 1137, 1095, 1082, 1063 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 58.45; H, 4.91; F, 4.87; N, 7.18; S, 8.21 実測値 (%): C, 58.46; H, 4.76; F, 4.57; N, 7.12; S, 8.18
lk-2	mp 206-208 $^{\circ}\text{C}$ (dec); $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 2.31 (s, 3H), 3.16 (s, 3H), 4.93 (s, 2H), 6.72 (dd, $J = 2.1, 8.4$ Hz, 1H), 7.09 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.29 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.38-7.44 (m, 2H), 7.55-7.60 (m, 2H); IR (Nujol) 3105, 3055, 2657, 2566, 1721, 1591, 1556, 1494, 1480, 1453, 1399, 1349, 1338, 1294, 1241, 1230, 1167, 1151, 1089, 1065 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{18}\text{H}_{17}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 57.44; H, 4.55; F, 5.05; N, 7.44; S, 8.52 実測値 (%): C, 57.50; H, 4.44; F, 4.99; N, 7.39; S, 8.47
lk-3	mp 172-178 $^{\circ}\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.02 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.53 (q, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.83 (s, 2H), 6.74 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 7.01 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.18 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.30-7.38 (m, 2H), 7.67-7.74 (m, 2H), 9.77 (s, 1H), 12.98 (br, 1H); IR (Nujol) 3254, 1726, 1589, 1487, 1410, 1377, 1333, 1289, 1246, 1233, 1167, 1088 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{19}\text{H}_{19}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 58.45; H, 4.91; F, 4.87; N, 7.18; S, 8.21 実測値 (%): C, 58.39; H, 4.88; F, 4.75; N, 7.21; S, 8.18
lk-4	mp 165-171 $^{\circ}\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.19 (d, $J = 6.9$ Hz, 6H), 2.20 (s, 3H), 3.05 (septet, $J = 6.9$ Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 6.75 (dd, $J = 1.8, 8.4$ Hz, 1H), 7.01 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.28 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.31-7.39 (m, 2H), 7.67-7.73 (m, 2H), 9.72 (s, 1H), 13.00 (br, 1H); IR (Nujol) 3250, 3124, 1741, 1591, 1483, 1377, 1318, 1293, 1200, 1146, 1088 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{20}\text{H}_{21}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 59.39; H, 5.23; F, 4.70; N, 6.93; S, 7.93 実測値 (%): C, 59.28; H, 5.19; F, 4.58; N, 6.93; S, 7.86
lk-5	mp 161-167 $^{\circ}\text{C}$; $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO) δ 1.02 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 2.23 (s, 3H), 2.55 (q, $J = 7.5$ Hz, 2H), 3.18 (s, 3H), 4.91 (s, 2H), 6.75 (dd, $J = 2.1, 8.7$ Hz, 1H), 6.96 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.28 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 7.38-7.45 (m, 2H), 7.55-7.62 (m, 2H), 12.99 (br, 1H); IR (Nujol) 3185, 1766, 1478, 1328, 1180, 1143, 1087 cm^{-1} ; 元素分析 ($\text{C}_{20}\text{H}_{21}\text{FN}_2\text{O}_4\text{S}$) 計算値 (%): C, 59.39; H, 5.23; F, 4.70; N, 6.93; S, 7.93 実測値 (%): C, 59.33; H, 5.16; F, 4.58; N, 6.93; S, 7.82

(表 8 2)

化合物 番号	物性値
Ik-6	Mp 210-217 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.18 (d, J = 7.2 Hz, 6H), 2.24 (s, 3H), 3.07 (septet, J = 7.2 Hz, 1H), 3.19 (s, 3H), 4.89 (s, 2H), 6.77 (dd, J = 2.1, 9.0 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.36-7.44 (m, 2H), 7.56-7.62 (m, 2H), 12.99 (br, 1H); IR (Nujol) 3241, 1771, 1750, 1587, 1482, 1324, 1178, 1086 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 60.27; H, 5.54; F, 4.54; N, 6.69; S, 7.66 実測値 (%): C, 60.04; H, 5.61; F, 4.30; N, 6.49; S, 7.30
Ik-7	Mp 121-124 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.90 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.43-1.55 (m, 2H), 2.10 (s, 3H), 2.64 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.18 (s, 3H), 4.89 (s, 2H), 6.69 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.22 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.40-7.47 (m, 2H), 7.60-7.66 (m, 2H), 12.97 (br, 1H); IR (Nujol) 3232, 1766, 1747, 1480, 1327, 1183, 1143, 1088 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 60.27; H, 5.54; F, 4.54; N, 6.69; S, 7.66 実測値 (%): C, 60.17; H, 5.51; F, 4.45; N, 6.73; S, 7.53
Ik-8	Mp 175-177 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.16 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 2.58 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.18 (s, 3H), 4.92 (s, 2H), 6.80 (dd, J = 2.1, 9.0 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.29 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.39-7.45 (m, 2H), 7.57-7.63 (m, 2H), 12.95 (br, 1H); IR (Nujol) 2655, 1730, 1711, 1591, 1481, 1389, 1345, 1251, 1177, 1156 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₉ H ₁₉ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 58.45; H, 4.91; F, 4.87; N, 7.18; S, 8.21 実測値 (%): C, 58.41; H, 4.94; F, 4.77; N, 7.03; S, 7.99
Ik-9	Mp 225-240 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.79 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.34-1.46 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.48 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 4.74 (s, 2H), 6.73 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.94 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.29-7.37 (m, 2H), 7.66-7.72 (m, 2H), 9.73 (brs, 1H); IR (Nujol) 3265, 1754, 1712, 1590, 1484, 1462, 1377, 1332, 1290, 1236, 1200, 1158, 1087 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₂₁ FN ₂ O ₄ S·0.2H ₂ O) 計算値 (%): C, 58.87; H, 5.29; F, 4.66; N, 6.87; S, 7.86 実測値 (%): C, 58.75; H, 5.12; F, 4.46; N, 6.82; S, 7.82
Ik-10	Mp 160-174 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.81 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.34-1.46 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.50 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 3.19 (s, 3H), 4.91 (s, 2H), 6.76 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.36-7.43 (m, 2H), 7.55-7.60 (m, 2H), 12.98 (br, 1H); IR (Nujol) 3243, 1767, 1587, 1482, 1325, 1178, 1140, 1085 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 60.27; H, 5.54; F, 4.54; N, 6.69; S, 7.66 実測値 (%): C, 60.22; H, 5.57; F, 4.32; N, 6.62; S, 7.59

(表 8 3)

化合物 番号	物性値
lk-11	Mp 165-173 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.90 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.05 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.39-1.49 (m, 2H), 2.53-2.62 (m, 4H), 4.81 (s, 2H), 6.75 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.13 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.32-7.36 (m, 2H), 7.70-7.75 (m, 2H), 9.79 (s, 1H); IR (Nujol) 3270, 2666, 1709, 1594, 1494, 1479, 1466, 1427, 1408, 1379, 1361, 1329, 1290, 1239, 1195, 1163, 1091 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 60.27; H, 5.54; F, 4.54; N, 6.69; S, 7.66 実測値 (%): C, 60.10; H, 5.49; F, 4.43; N, 6.63; S, 7.63
lk-12	mp 182-190 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.91 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.09 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.53 (m, 2H), 2.53-2.63 (m, 4H), 4.83 (s, 2H), 6.79 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.05-7.08 (m, 1H), 7.12 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.39-7.41 (m, 1H), 7.82-7.84 (m, 1H), 9.90 (s, 1H); IR (Nujol) 3249, 3103, 3081, 2660, 1708, 1480, 1468, 1429, 1404, 1378, 1362, 1334, 1235, 1198, 1158, 1091, 1017 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₉ H ₂₂ N ₂ O ₄ S ₂) 計算値 (%): C, 56.14; H, 5.45; N, 6.89; S, 15.78 実測値 (%): C, 56.05; H, 5.45; N, 6.74; S, 15.56
lk-13	mp 134-137 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.91 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.04 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.41-1.54 (m, 2H), 2.54-2.65 (m, 4H), 3.18 (s, 3H), 4.88 (s, 2H), 6.76 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.96 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.38-7.44 (m, 2H), 7.57-7.63 (m, 2H), 13.09 (br, 1H); IR (Nujol) 3063, 2659, 2558, 2464, 1706, 1592, 1493, 1476, 1430, 1418, 1378, 1343, 1322, 1291, 1234, 1194, 1168, 1149, 1085, 1064 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₅ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 61.09; H, 5.83; F, 4.39; N, 6.48; S, 7.41 実測値 (%): C, 61.05; H, 5.79; F, 4.25; N, 6.40; S, 7.45
lk-14	mp 130-132 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.92 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.07 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.42-1.54 (m, 2H), 2.54-2.66 (m, 4H), 3.21 (s, 3H), 4.89 (s, 2H), 6.77 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.22 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.22-7.25 (m, 2H), 7.47 (dd, J = 1.2, 3.6 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 1.2, 5.1 Hz, 1H), 12.99 (br, 1H); IR (Nujol) 3102, 3075, 2654, 2554, 1723, 1477, 1422, 1405, 1379, 1350, 1236, 1227, 1194, 1149, 1085, 1061, 1015 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₂₄ N ₂ O ₄ S ₂) 計算値 (%): C, 57.12; H, 5.75; N, 6.66; S, 15.25 実測値 (%): C, 56.90; H, 5.74; N, 6.60; S, 15.17
lk-15	mp 235-250 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.80 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.34-1.47 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.48 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 3.75 (s, 3H), 4.69 (s, 2H), 6.72 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.95 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.96-7.01 (m, 2H), 7.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.52-7.57 (m, 2H), 9.52 (brs, 1H); IR (Nujol) 3254, 1744, 1596, 1485, 1460, 1375, 1260, 1170, 1092, 1028 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₄ N ₂ O ₅ S·0.4H ₂ O) 計算値 (%): C, 59.53; H, 5.90; N, 6.61; S, 7.57 実測値 (%): C, 59.61; H, 5.69; N, 6.61; S, 7.57

(表 8 4)

化合物 番号	物性値
lk-16	mp 152-162 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.82 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.34-1.46 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.49 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 3.14 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 4.91 (s, 2H), 6.76 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.04-7.09 (m, 2H), 7.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.42-7.47 (m, 2H), 12.97 (br, 1H); IR (Nujol) 3222, 1765, 1741, 1593, 1482, 1379, 1327, 1306, 1265, 1177, 1142, 1088, 1017 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₆ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 61.38; H, 6.09; N, 6.51; S, 7.45 実測値 (%): C, 61.26; H, 6.12; N, 6.52; S, 7.51
lk-17	mp 173-183 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.90 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.05 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.51 (m, 2H), 2.53-2.61 (m, 4H), 3.76 (s, 3H), 4.80 (s, 2H), 6.75 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 6.99-7.02 (m, 2H), 7.04 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.59-7.62 (m, 2H), 9.61 (s, 1H); IR (Nujol) 3241, 3170, 3013, 1759, 1732, 1597, 1577, 1498, 1478, 1466, 1383, 1355, 1321, 1263, 1190, 1146, 1090, 1028 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₆ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 61.38; H, 6.09; N, 6.51; S, 7.45 実測値 (%): C, 61.05; H, 6.05; N, 6.51; S, 7.32
lk-18	mp 114-116 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.92 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.04 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.41-1.54 (m, 2H), 2.54-2.65 (m, 4H), 3.14 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 4.88 (s, 2H), 6.76 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.94 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.07-7.09 (m, 2H), 7.21 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.45-7.48 (m, 2H); IR (Nujol) 3314, 3100, 3067, 1767, 1742, 1596, 1579, 1497, 1480, 1465, 1377, 1342, 1318, 1302, 1263, 1168, 1138, 1088, 1060 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₀ F ₂ N ₂ O ₄ S·0.2AcOEt) 計算値 (%): C, 61.85; H, 6.46; N, 6.06; S, 6.94 実測値 (%): C, 61.66; H, 6.47; N, 6.08; S, 6.88
lk-19	mp 162-169 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 2.29 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.91 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 6.78 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.94 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.06-7.36 (m, 8H), 7.49-7.56 (m, 2H), 13.02 (br, 1H); IR (Nujol) 3149, 1739, 1590, 1476, 1415, 1376, 1346, 1165, 1151 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₅ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 64.36; H, 4.97; F, 4.07; N, 6.00; S, 6.87 実測値 (%): C, 64.31; H, 4.88; F, 3.95; N, 5.97; S, 6.73
lk-20	mp 192-197 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 2.29 (s, 3H), 3.08 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 3.92 (s, 2H), 4.94 (s, 2H), 6.75 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.96-7.24 (m, 8H), 7.29 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.40-7.44 (m, 2H), 13.02 (br, 1H); IR (Nujol) 1703, 1598, 1496, 1479, 1338, 1256, 1146, 1090, 1027 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₆ H ₂₆ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 65.25; H, 5.48; N, 5.85; S, 6.70 実測値 (%): C, 64.95; H, 5.49; N, 5.70; S, 6.35

(表 8 5)

化合物 番号	物性値
lk-21	mp 140-147 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.80 (d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.60 (septet, J = 6.6 Hz, 1H), 2.22 (s, 3H), 2.38 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 3.19 (s, 3H), 4.92 (s, 2H), 6.78 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.35-7.43 (m, 2H), 7.55-7.62 (m, 2H), 12.98 (br, 1H); IR (Nujol) 3253, 1766, 1587, 1481, 1324, 1177, 1139, 1085 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₅ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 61.09; H, 5.83; F, 4.39; N, 6.48; S, 7.41 実測値 (%): C, 60.97; H, 5.75; F, 4.23; N, 6.37; S, 7.32
lk-22	mp 137-142 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.85 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.14-1.40 (m, 4H), 2.19 (s, 3H), 2.50 (t-like, 2H), 4.84 (s, 2H), 6.76 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.19 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.30-7.36 (m, 2H), 7.67-7.72 (m, 2H), 12.98 (br, 1H); IR (Nujol) 3255, 3106, 3041, 2652, 2550, 1714, 1592, 1484, 1466, 1407, 1378, 1351, 1332, 1290, 1233, 1199, 1169, 1159, 1091 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 60.27; H, 5.54; F, 4.54; N, 6.69; S, 7.66 実測値 (%): C, 60.22; H, 5.52; F, 4.39; N, 6.78; S, 7.56
lk-23	mp 130-140 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.86 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.15-1.42 (m, 4H), 2.18 (s, 3H), 2.50 (t-like, 2H), 3.76 (s, 3H), 4.82 (s, 2H), 6.75 (dd, J = 2.1, 9.0 Hz, 1H), 6.97 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.97-7.02 (m, 2H), 7.16 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.56-7.61 (m, 2H), 9.57 (s, 1H), 12.95 (br, 1H); IR (Nujol) 3248, 3076, 2651, 2553, 1714, 1598, 1578, 1499, 1484, 1465, 1410, 1379, 1328, 1301, 1261, 1232, 1181, 1157, 1093, 1029 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₆ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 61.38; H, 6.09; N, 6.51; S, 7.45 実測値 (%): C, 61.21; H, 6.04; N, 6.48; S, 7.27
lk-24	mp 125-129 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.86 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.17-1.40 (m, 4H), 2.22 (s, 3H), 2.50 (t-like, 2H), 3.19 (s, 3H), 4.90 (s, 2H), 6.78 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.36-7.43 (m, 2H), 7.55-7.61 (m, 2H), 13.03 (br, 1H); IR (Nujol) 3253, 3121, 3091, 3074, 1768, 1591, 1479, 1416, 1377, 1327, 1292, 1229, 1186, 1166, 1137, 1099, 1087, 1072, 1055 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₅ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 61.09; H, 5.83; F, 4.39; N, 6.48; S, 7.41 実測値 (%): C, 61.10; H, 5.72; F, 4.31; N, 6.46; S, 7.39
lk-25	mp 140-145 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.86 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.18-1.41 (m, 4H), 2.22 (s, 3H), 2.50 (t-like, 2H), 3.14 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 4.90 (s, 2H), 6.76 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.04-7.09 (m, 2H), 7.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.42-7.47 (m, 2H), 12.98 (br, 1H); IR (Nujol) 3241, 3090, 3066, 3016, 1764, 1737, 1702, 1593, 1576, 1495, 1481, 1467, 1457, 1415, 1378, 1328, 1305, 1264, 1172, 1141, 1087, 1017 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₃ H ₂₈ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 62.14; H, 6.35; N, 6.30; S, 7.21 実測値 (%): C, 62.04; H, 6.23; N, 6.29; S, 7.09

(表 8 6)

化合物 番号	物性値
lk-26	mp 139-147 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.79 (d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.63 (m, 1H), 2.18 (s, 3H), 2.37 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 3.76 (s, 3H), 4.84 (s, 2H), 6.75 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.96-7.01 (m, 2H), 7.16 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.55-7.60 (m, 2H), 9.54 (s, 1H), 12.90 (br, 1H); IR (Nujol) 3325, 3254, 3098, 3077, 1748, 1595, 1578, 1484, 1464, 1436, 1418, 1378, 1333, 1317, 1304, 1291, 1260, 1203, 1166, 1141, 1112, 1091 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₆ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 61.38; H, 6.09; N, 6.51; S, 7.45 実測値 (%): C, 61.13; H, 6.13; N, 6.55; S, 7.24
lk-27	mp 148-160 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.80 (d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.61 (m, 1H), 2.22 (s, 3H), 2.37 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 3.15 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 4.91 (s, 2H), 6.77 (dd, J = 2.1, 8.4 Hz, 1H), 6.84 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.03-7.08 (m, 2H), 7.26 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.42-7.47 (m, 2H), 12.96 (br, 1H); IR (Nujol) 3252, 3097, 3077, 3058, 3025, 1750, 1724, 1595, 1577, 1482, 1465, 1415, 1373, 1320, 1305, 1270, 1212, 1188, 1163, 1144, 1091, 1053, cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₃ H ₂₈ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 62.14; H, 6.35; N, 6.30; S, 7.21 実測値 (%): C, 62.16; H, 6.39; N, 6.32; S, 7.22
lk-28	mp 150-175 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.82 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.33-1.45 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.48 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.58 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 4.91 (s, 2H), 6.71 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.04-7.09 (m, 2H), 7.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.48-7.53 (m, 2H), 12.97 (br, 1H); IR (Nujol) 3178, 1762, 1742, 1728, 1594, 1577, 1476, 1379, 1328, 1306, 1261, 1181, 1139 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₃ H ₂₈ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 62.14; H, 6.35; N, 6.30; S, 7.21 実測値 (%): C, 61.87; H, 6.31; N, 6.33; S, 6.94
lk-29	mp 153-165 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.83 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.48 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.50 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.12 (s, 3H), 4.89 (s, 2H), 6.74 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.83-6.88 (m, 2H), 6.91 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.31-7.36 (m, 2H), 10.48 (br, 1H), 13.03 (br, 1H); IR (Nujol) 3177, 1719, 1586, 1479, 1442, 1377, 1335, 1241, 1222, 1152 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₄ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 60.56; H, 5.81; N, 6.73; S, 7.70 実測値 (%): C, 60.38; H, 5.94; N, 6.52; S, 7.32
lk-30	mp 202-210 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 2.27 (s, 3H), 3.89 (s, 2H), 4.88 (s, 2H), 6.75 (dd, J = 2.1, 8.4 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.07-7.33 (m, 8H), 7.62-7.68 (m, 2H), 7.97 (s, 1H), 12.98 (br, 1H); IR (Nujol) 3263, 1709, 1594, 1481, 1411, 1379, 1334, 1292, 1234, 1169 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₁ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 63.70; H, 4.68; F, 4.20; N, 6.19; S, 7.09 実測値 (%): C, 63.47; H, 4.75; F, 3.93; N, 6.17; S, 6.74

(表 8 7)

化合物 番号	物性値
lk-31	mp 130-155 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.82 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.33-1.45 (m, 5H), 2.23 (s, 3H), 2.49 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.14 (s, 3H), 4.10 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 4.90 (s, 2H), 6.76 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.02-7.07 (m, 2H), 7.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.40-7.45 (m, 2H), 12.93 (br, 1H); IR (Nujol) 3247, 1739, 1594, 1480, 1415, 1377, 1304, 1256, 1153 cm ⁻¹ .
lk-32	mp 90-96 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.81 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.33-1.45 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.48 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.19 (t, J = 2.4 Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 4.46 (q, J = 2.4 Hz, 2H), 4.90 (s, 2H), 6.82 (dd, J = 2.1, 8.4 Hz, 1H), 6.98 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.04-7.09 (m, 2H), 7.28 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.53-7.58 (m, 2H), 13.03 (br, 1H); IR (Nujol) 3588, 3310, 2642, 1733, 1707, 1687, 1599, 1580, 1499, 1479, 1465, 1414, 1379, 1345, 1257, 1159, 1029 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₆ N ₂ O ₅ S·0.8H ₂ O) 計算値 (%): C, 61.47; H, 5.93; N, 5.97; S, 6.84 実測値 (%): C, 61.56; H, 5.69; N, 5.87; S, 6.58
lk-33	mp 144-157 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 2.29 (s, 3H), 3.10 (t, J = 2.1 Hz, 1H), 3.82 (s, 2H), 3.89 (s, 2H), 4.41 (d, J = 2.1 Hz, 2H), 4.94 (s, 2H), 6.82 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.00-7.24 (m, 8H), 7.31 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.52-7.55 (m, 2H), 13.06 (br, 1H); IR (Nujol) 3291, 2644, 1933, 1716, 1598, 1579, 1498, 1475, 1346, 1335, 1262, 1240, 1158, 1095 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₈ H ₂₆ N ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 66.91; H, 5.21; N, 5.57; S, 6.38 実測値 (%): C, 66.65; H, 5.26; N, 5.56; S, 6.14
lk-34	mp 123-130 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.80 (d, J = 6.9 Hz, 6H), 1.59 (septet, J = 6.9 Hz, 1H), 2.22 (s, 3H), 2.37 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 3.22 (t, J = 2.4 Hz, 1H), 4.52 (d, J = 2.4 Hz, 2H), 4.92 (s, 2H), 6.84 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 6.96 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.35-7.42 (m, 2H), 7.67-7.72 (m, 2H), 13.03 (br, 1H); IR (Nujol) 3307, 2654, 1732, 1592, 1493, 1475, 1379, 1350, 1246, 1168, 1096 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₄ H ₂₅ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 63.14; H, 5.52; F, 4.16; N, 6.14; S, 7.02 実測値 (%): C, 62.99; H, 5.36; F, 4.25; N, 6.13; S, 7.44
lk-35	mp 157-160 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 2.21 (s, 3H), 3.18 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 4.90 (s, 2H), 6.77 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.38-7.55 (m, 2H), 7.56-7.62 (m, 2H), 13.05 (br, 1H); IR (Nujol) 1741, 1592, 1485, 1469, 1385, 1343, 1298, 1292, 1267, 1240, 1204, 1171, 1090, 1059 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₁₉ H ₁₉ FN ₂ O ₅ S) 計算値 (%): C, 56.15; H, 4.71; F, 4.67; N, 6.89; S, 7.89 実測値 (%): C, 56.28; H, 4.62; F, 4.37; N, 6.90; S, 7.70

(表 8 8)

化合物 番号	物性値
lk-36	mp 170-180 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 2.21 (s, 3H), 3.14 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 4.90 (s, 2H), 6.77 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.98 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.06-7.11 (m, 2H), 7.32 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.43-7.48 (m, 2H), 13.03 (br, 1H); IR (Nujol) 1726, 1597, 1498, 1479, 1415, 1383, 1338, 1305, 1266, 1254, 1150, 1091, 1026, 1011 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₀ H ₂₂ N ₂ O ₆ S) 計算値 (%): C, 57.40; H, 5.30; N, 6.69; S, 7.66 実測値 (%): C, 56.78; H, 5.33; N, 6.64; S, 7.30
lk-37	mp 142-152 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 1.04 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 2.63 (s, 3H), 2.72 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.17 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 5.11 (s, 2H), 6.93 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.08-7.13 (m, 2H), 7.46-7.51 (m, 4H), 13.30 (br, 1H); IR (Nujol) 3544, 3355, 1734, 1693, 1598, 1577, 1513, 1498, 1477, 1459, 1412, 1378, 1341, 1262, 1208, 1161, 1149, 1107, 1092, 1066, 1034 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₄ N ₂ O ₆ S·0.4H ₂ O) 計算値 (%): C, 58.50; H, 5.53; N, 6.20; S, 7.10 実測値 (%): C, 58.43; H, 5.67; N, 6.23; S, 6.88
lk-38	mp 105-115 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.97 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.03 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 2.63 (s, 3H), 2.69 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.61 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.84 (s, 3H), 5.12 (s, 2H), 6.89 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 7.08-7.13 (m, 2H), 7.41 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.49-7.57 (m, 3H), 13.32 (br, 1H); IR (Nujol) 3313, 1729, 1631, 1596, 1576, 1509, 1496, 1479, 1461, 1446, 1412, 1378, 1337, 1260, 1221, 1188, 1147, 1107, 1092, 1065, 1028 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₃ H ₂₆ N ₂ O ₆ S·0.5H ₂ O) 計算値 (%): C, 59.09; H, 5.82; N, 5.99; S, 6.86 実測値 (%): C, 59.18; H, 5.72; N, 6.11; S, 6.99
lk-39	mp 169-176 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.81 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.33-1.45 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.49 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.18 (s, 3H), 4.90 (s, 2H), 6.73 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.51-7.59 (m, 4H), 7.70 (m, 1H), 13.00 (br, 1H); IR (Nujol) 3060, 2756, 2658, 2564, 1729, 1708, 1584, 1480, 1447, 1415, 1380, 1335, 1307, 1246, 1170, 1146, 1085, 1069, 1053 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₄ N ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 62.98; H, 6.04; N, 6.99; S, 8.01 実測値 (%): C, 62.88; H, 5.76; N, 6.93; S, 7.95
lk-40	mp 130-136 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.82 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.33-1.45 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.50 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 3.18 (s, 3H), 4.90 (s, 2H), 6.74 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.34-7.42 (m, 4H), 13.00 (br, 1H); IR (Nujol) 3284, 3048, 1750, 1722, 1597, 1580, 1481, 1456, 1416, 1375, 1338, 1321, 1308, 1290, 1205, 1193, 1166, 1146, 1087, 1055 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₂ H ₂₆ N ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 63.75; H, 6.32; N, 6.76; S, 7.74 実測値 (%): C, 63.58; H, 6.05; N, 6.73; S, 7.94

(表 8 9)

化合物 番号	物性値
lk-41	mp 152-159 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.79 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.31-1.43 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.48 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 3.32 (s, 3H), 4.89 (s, 2H), 6.80 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.25-7.31 (m, 2H), 7.46-7.53 (m, 2H), 7.73 (m, 1H), 13.01 (br, 1H); IR (Nujol) 3081, 3026, 2756, 2656, 2596, 2562, 1730, 1709, 1596, 1475, 1448, 1416, 1380, 1350, 1269, 1244, 1211, 1182, 1172, 1142, 1124, 1072, 1051 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₃ FN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 60.27; H, 5.54; F, 4.54; N, 6.69; S, 7.66 実測値 (%): C, 60.29; H, 5.36; F, 4.57; N, 6.63; S, 7.62
lk-42	mp 147-154 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.82 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.33-1.45 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.49 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 3.19 (s, 3H), 4.91 (s, 2H), 6.77 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.49-7.53 (m, 2H), 7.61-7.65 (m, 2H), 12.99 (br, 1H); IR (Nujol) 3276, 3097, 1770, 1581, 1479, 1417, 1396, 1378, 1324, 1185, 1174, 1162, 1143, 1092, 1055, 1011 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₃ ClN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 57.99; H, 5.33; Cl, 8.15; N, 6.44; S, 7.37 実測値 (%): C, 58.05; H, 5.01; Cl, 7.79; N, 6.46; S, 7.36
lk-43	mp 143-150 °C; ¹ H-NMR (d ₆ -DMSO) δ 0.83 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.33-1.45 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.49 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 3.19 (s, 3H), 4.91 (s, 2H), 6.78 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.41-7.45 (m, 2H), 7.75-7.79 (m, 2H), 12.98 (br, 1H); IR (Nujol) 3021, 2655, 1717, 1574, 1478, 1467, 1415, 1387, 1377, 1357, 1251, 1190, 1170, 1156, 1069 cm ⁻¹ ; 元素分析 (C ₂₁ H ₂₃ BrN ₂ O ₄ S) 計算値 (%): C, 52.61; H, 4.84; Br, 16.67; N, 5.84; S, 6.69 実測値 (%): C, 52.70; H, 4.56; Br, 16.11; N, 5.82; S, 6.67

試験例 1 C R T H 2 受容体結合試験

ヒト C R T H 2 受容体を発現した K 5 6 2 細胞から細胞膜画分を調製し、結合
5 実験に供した。結合反応液 (50 mM Tris/HCl, pH 7.4, 10 mM MgCl₂)
に膜画分 (0.06 mg) および 3 nM ³H-PGD₂ (172 Ci/mmol)を加えて 0.1 ml
とし、室温で 60 分間反応させた。反応終了後速やかにガラス繊維濾紙を用いて濾
過し、冷生理食塩水で数回洗浄し、濾紙に残った放射活性を測定した。特異的結
合は全結合量から非特異的結合量 (10 μM PGD₂ 存在下で同様にして求めた
10 放射活性量) を差し引いて算出した。各化合物の結合阻害活性は、化合物非存在
下での特異的結合量を 100%とし、各化合物存在下での特異的結合量 (%) を求

めて置換曲線を作成することにより、50%抑制濃度（IC₅₀値）を算出した。結果を以下の表に示す。

（表 9 0）

化合物番号	C R T H 2 結合阻害活性 IC ₅₀ (μM)
Ia-15	0.037
Ia-20	0.022
Ia-32	0.018
Ia-36	0.015
Ia-39	0.045
Ia-41	0.034
Ia-44	0.023
Ia-45	0.019
Ia-47	0.051
Ia-48	0.057
Ia-51	0.02
Ia-52	0.024
Ia-55	0.042
Ia-57	0.057
Ia-58	0.033
Ia-59	0.023
Ia-61	0.045
Ia-62	0.049
Ia-63	0.054
Ia-65	0.027
Ia-66	0.037
Ia-85	0.08
Ib-6	0.055
(+)-Ib-16	0.0059
(+)-Ib-18	0.013
(+)-Ib-20	0.0079
Ib-21	0.012
(+)-Ib-25	0.0036

(表 9 1)

化合物番号	C R T H 2 結合阻害活性 I C ₅₀ (μ M)
(+)-Ib-27	0.0062
(+)-Ib-29	0.0049
Ib-30	0.0053
Ib-31	0.059
Ic-2	0.021
Ic-6	0.0045
Ic-14	0.0055
Ic-24	0.068
Ie-2	0.039
Ie-5	0.018
Ie-8	0.026
If-1	0.019
If-4	0.016
If-9	0.012
Ig-3	0.0097
Ig-4	0.0078
Ig-11	0.01
Ig-14	0.0083
Ig-15	0.0075
Ig-16	0.0036
Ig-18	0.019
Ih-2	0.0099
Ih-3	0.033
Ih-4	0.024
Ih-5	0.023
Ih-6	0.034
Ii-1	0.035
Ii-2	0.035
Ii-3	0.064
Ij-1	0.026
Ij-2	0.053
Ij-3	0.053

(表 9 2)

化合物番号	C R T H 2 結合阻害活性 I C ₅₀ (μM)
lk-1	0.048
lk-2	0.086
lk-3	0.051
lk-4	0.047
lk-5	0.019

試験例 2 CRTH2 受容体に対する拮抗活性試験

CRTH2 受容体に対する拮抗活性を、化合物の PGD₂ 刺激による CRTH2 受容体を介した細胞内カルシウム濃度上昇に対する抑制作用を検討することによって行った。

5

ヒト CRTH2 受容体を発現した K562 細胞を 2×10^6 cells/ml に調製し、細胞懸濁液 (10 mM HEPES buffer, pH 7.4, 0.1% Bovine serum albumin) に Fura-2 AM (2 μM) を加えて室温で 60 分間インキュベートした。洗浄後、再度細胞懸濁液に懸濁させ 37 度に加温後、種々の濃度に希釈した化合物を添加し、その 2 分後に PGD₂ (50 nM) を添加して反応を惹起させ、細胞内カルシウム濃度の上昇を細胞内イオン測定装置 (CAF-110) を用いて測定した。各化合物の拮抗活性は、化合物非存在下での細胞内カルシウム濃度上昇量に対する各化合物存在下 (1 μM) での抑制率を算出して評価した。結果を以下の表に示す。

10

(表 9 3)

化合物番号	CRTH2 拮抗活性 (%INH)
Ia-9	94
Ia-51	91
Ib-31	96
Ib-16	100
Ib-25	100
Ic-6	100
Ib-29	100
Ia-36	89
Ic-19	91
Ic-31	98
Ic-34	94
Ic-53	60
Ic-54	85
Ic-55	100
Ic-56	100
Ic-57	100
Ih-2	91

上記の表に示した結果から、本発明化合物が優れた C R T H 2 受容体拮抗活性を有することがわかる。

5

製剤例

製剤例 1

以下の成分を含有する顆粒剤を製造する。

成分	式 (I) で表わされる化合物	10 mg
10	乳糖	700 mg
	コーンスターチ	274 mg
	HPC-L	16 mg
		1000 mg

式 (I) で表わされる化合物と乳糖を 6 0 メッシュのふるいに通す。コーン
 15 ターチを 1 2 0 メッシュのふるいに通す。これらを V 型混合機にて混合する。混
 合末に H P C - L (低粘度ヒドロキシプロピルセルロース) 水溶液を添加し、練
 合、造粒 (押し出し造粒 孔径 0 . 5 ~ 1 m m) したのち、乾燥する。得られた

乾燥顆粒を振動ふるい（12 / 60メッシュ）で櫛過し顆粒剤を得る。

製剤例 2

以下の成分を含有するカプセル充填用散剤を製造する。

5	成分	式（I）で表わされる化合物	10 mg
		乳糖	79 mg
		コーンスターチ	10 mg
		<u>ステアリン酸マグネシウム</u>	<u>1 mg</u>
			100 mg

式（I）で表わされる化合物、乳糖を60メッシュのふるいに通す。コーン
 10 ターチは120メッシュのふるいに通す。これらとステアリン酸マグネシウムを
 V型混合機にて混合する。10倍散100mgを5号硬ゼラチンカプセルに充填
 する。

製剤例 3

15 以下の成分を含有するカプセル充填用顆粒剤を製造する。

20	成分	式（I）で表わされる化合物	15 mg
		乳糖	90 mg
		コーンスターチ	42 mg
		<u>HPC-L</u>	<u>3 mg</u>
			150 mg

式（I）で表わされる化合物、乳糖を60メッシュのふるいに通す。コーン
 ターチを120メッシュのふるいに通す。これらを混合し、混合末にHPC-L
 溶液を添加して練合、造粒、乾燥する。得られた乾燥顆粒を整粒後、その150
 mgを4号硬ゼラチンカプセルに充填する。

25 製剤例 4

以下の成分を含有する錠剤を製造する。

成分	式（I）で表わされる化合物	10 mg
----	---------------	-------

乳糖	90 mg
微結晶セルロース	30 mg
CMC-Na	15 mg
ステアリン酸マグネシウム	5 mg

150 mg

5

式（I）で表わされる化合物、乳糖、微結晶セルロース、CMC-Na（カルボキシメチルセルロース ナトリウム塩）を60メッシュのふるいに通し、混合する。混合末にステアリン酸マグネシウム混合し、製錠用混合末を得る。本混合末を直打し、150mgの錠剤を得る。

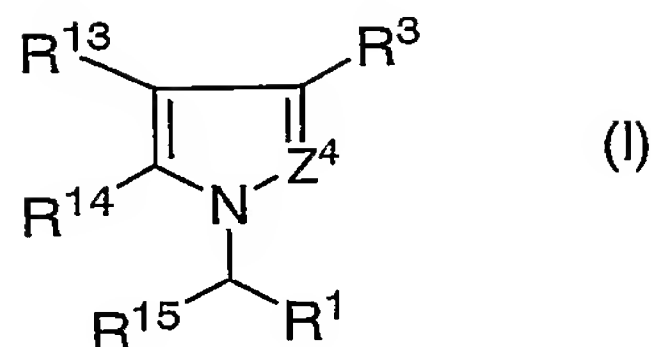
10

産業上の利用可能性

本発明医薬組成物および本発明化合物は、優れたCRTH2受容体拮抗作用を示し、アレルギー性疾患の治療または予防剤等として有効に機能し得る。

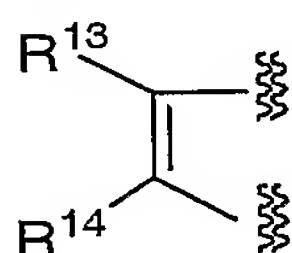
請求の範囲

1. 式 (I) :

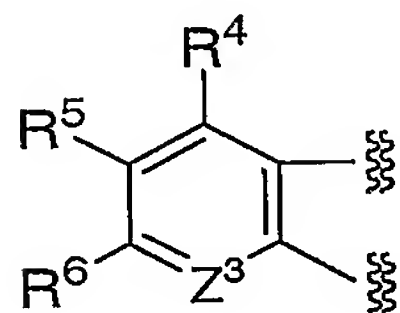


(式中、

5 式 :



で示される基は式 :



(式中、 Z^3 は $=N-$ または $=C(-R^7)-$; R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 はそれ

- 10 それ独立して水素、ハロゲン、ハロアルキル、カルボキシ、アルキルオキシカルボニル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいアラルキル、式： $-S(O)_pR^8$ (式中、 p は0~2の整数; および R^8 はアルキルまたは置換されていてもよいアリール)で示される基、式：
15 $-NR^9R^{10}$ (式中、 R^9 および R^{10} はそれぞれ独立して水素、アルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキルまたはアシル)で示される基、式： $-OR^{11}$ (式中、 R^{11} は水素、アルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル、アルカンスルホニル、置換されていてもよいアリールスルホニル、置換されていてもよいアラルキルスルホニル、ハロアルキル)で示される基)で示される基 ;
20

R^1 はカルボキシ、アルキルオキシカルボニル、置換されていてもよいアミノカルボニルまたはテトラゾリル ;

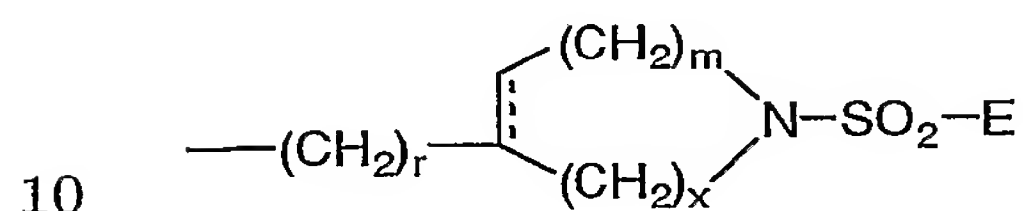
Z^4 は $-N=$ または $-C(-R^2)=$;

R^2 は水素、アルキルまたはハロゲン ;

R^{15} は水素またはアルキル ;

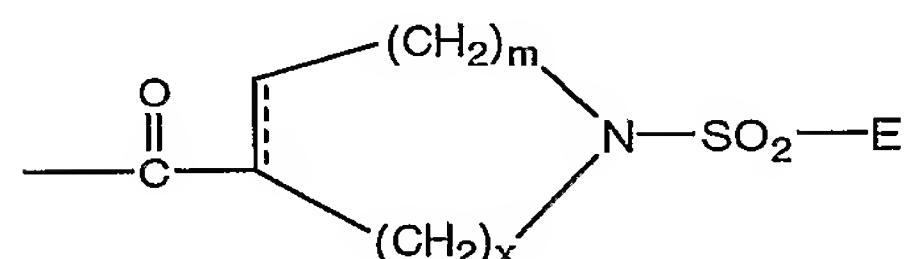
R^3 は式 : $-(CH_2)_n-N(-Y)-SO_2-Ar$ (式中、 n は 1 ~ 3 の整数 ;

- 5 Y は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル、置換されていてもよいヘテロアリールアルキルまたは置換されていてもよいアリールアルケニル ; および Ar は置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリール) で示される基、式 :



(式中、 r は 0 ~ 2 の整数 ; x は 0 ~ 3 の整数 ; m は 1 ~ 3 の整数 ; 破線は結合の存在または不存在を表わし ; E は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、アルキル、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいアリールアルケニル) で示される基、

- 15 式 :

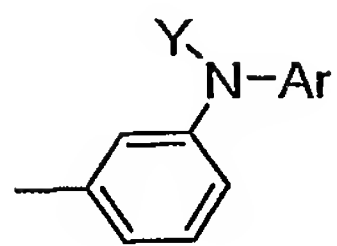


(式中、 x は 0 ~ 3 の整数 ; m は 1 ~ 3 の整数 ; 破線は結合の存在または不存在を表わし ; E は置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、アルキル、置換されていてもよいアラルキルまたは置換されていてもよいアリールアルケニル) で示される基、

- 20 式 : $-CR^{23}R^{24}-CR^{25}R^{26}-(CH_2)_y-N(-Y)-SO_2-Ar$ (式中、 Ar および Y は前記と同意義 ; y は 0 または 1 ; R^{23} および R^{24} の一方はアルキル、他方は水素、アルキルまたはアリール ; または R^{23} および R^{24} は一緒に
- 25 R^{25} および R^{26} はそれぞれ独立して水素またはアルキルオキシアルキル) で示され

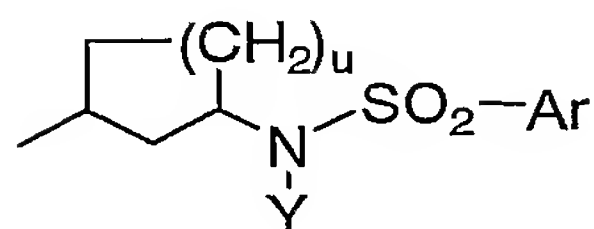
る基、

式：



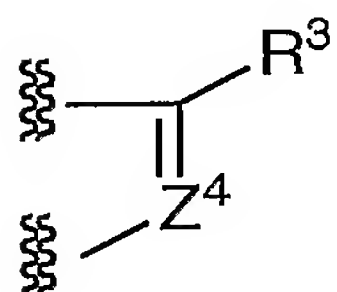
(式中、Y および A r は前記と同意義) で示される基、または

5 式：

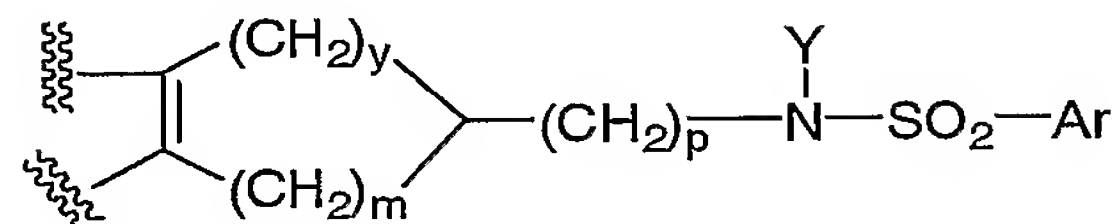


(式中、Y および A r は前記と同意義；u は 1 または 2) で示される基；

または式：

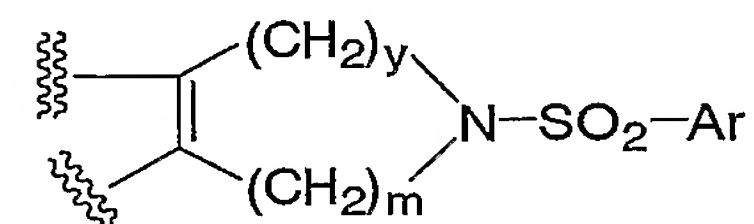


10 で示される基が式：



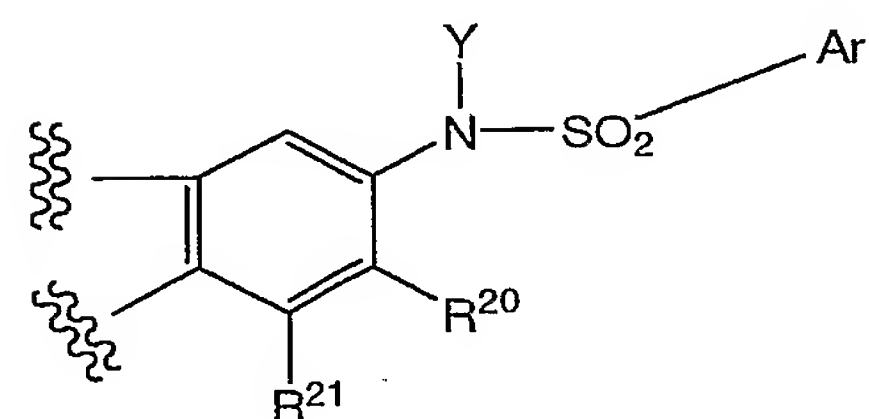
(y は 1 ～ 3 の整数；m、p、Y および A r は前記と同意義) で示される基、

式：



15 (m、y および A r は前記と同意義) で示される基、

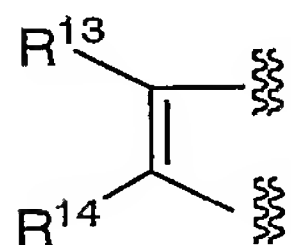
または式：



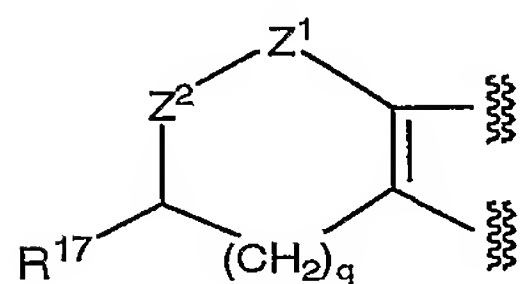
(Y および A r は前記と同意義；R²⁰ は水素またはアルキル；R²¹ は水素また

はハロゲン)で示される基である。(但し、3-(4-クロロフェニルスルホニルアミノ)-9-(2-カルボキシメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロカルバゾール、そのエチルエステル、3-(4-クロロフェニルスルホニルアミノエチル)インドール-1-アセティックアシッド、および3-(4-クロロフェニルスルホニルアミノプロピル)インドール-1-アセティックアシッドを除く) ;

または R^{13} が水素、アルキル、アラルキル、アシルまたは式: $-OR^{16}$ (式中、 R^{16} は水素またはアルキル) で示される基であり、 R^{14} が水素またはアルキルであるか、または式:



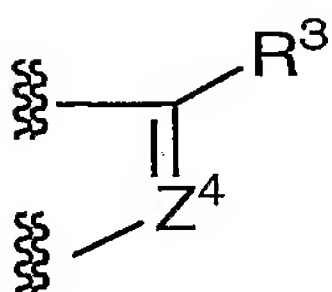
10 で示される基が式:



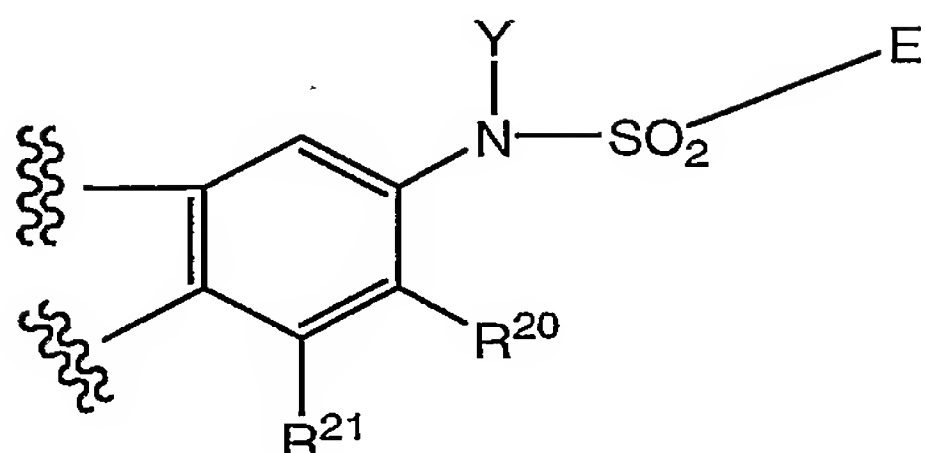
(式中、 q は 0 ~ 3 の整数 ; R^{17} は水素またはアルキル ; Z^1 は $-CH_2-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=NOH)-$ 又は $-C(=NOMe)-$; Z^2 は式: $-S(=O)_s-$ (式中、 s は 0 ~ 2 の整数) で示される基、式: $-N(-R^{22})-$ (式中、 R^{22} は水素、アルキル、アルキルオキシカルボニルまたはアシル) で示される基または式: $-CR^{18}R^{19}-$ (式中、 R^{18} および R^{19} はそれぞれ独立して水素、アルキルまたはアリール ; または R^{18} および R^{19} は一緒になって式: $-(CH_2)_t-$ (式中、 t は 2 ~ 5 の整数) で示される基である) で示される基である) で示される基であり ;

20 R^1 および R^{15} は前記と同意義であり ;

式:

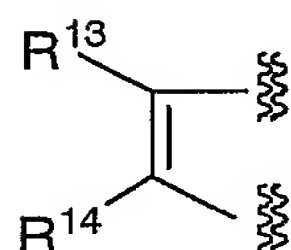


で示される基が式：

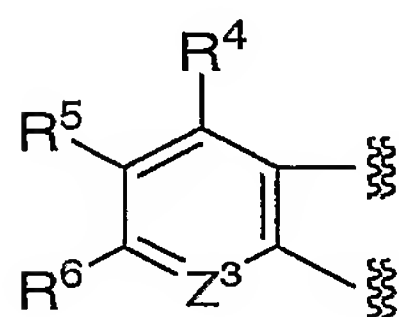


(Y、E、R²⁰およびR²¹は前記と同意義)で示される基である化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

5 2. 式：



で示される基が式：

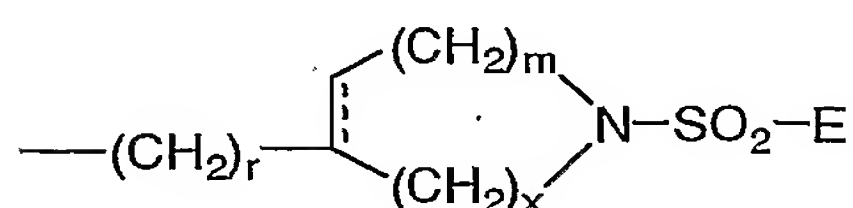


(式中、Z³は=C(R⁷)-であり；R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷は請求の範囲第1項と同意義)で示される基であり；Z⁴が-C(R²)=であり；R²は請求の範囲第1項と同意義であり；R¹⁵が水素であり；

R³が式： $-(CH_2)_n-N(Y)-SO_2-Ar$ (式中、nは1～3の整数；

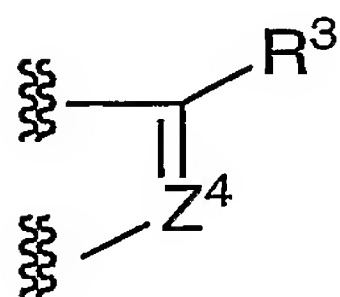
Yは水素、アルキル、アルケニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアラルキル、または置換されていてもよいヘテロアリールアルキル；

15 およびArは置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリール)で示される基、式：

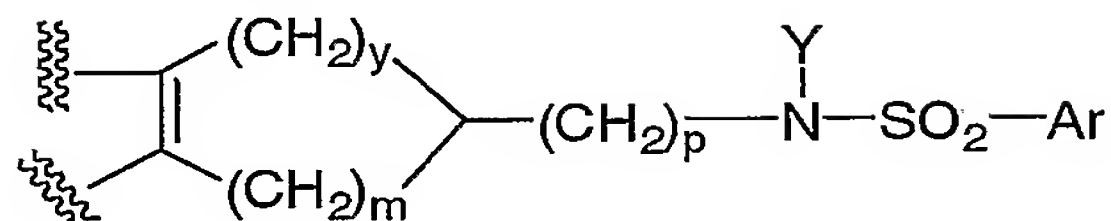


(式中、rは0～2の整数；xは0～3の整数；mは1～3の整数；破線は結合の存在または不存在を表わし；Eは置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリール)で示される基；

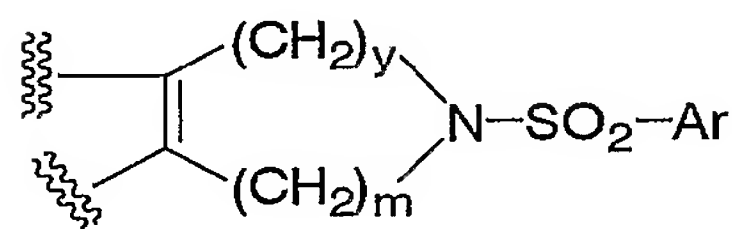
または式：



で示される基が式：

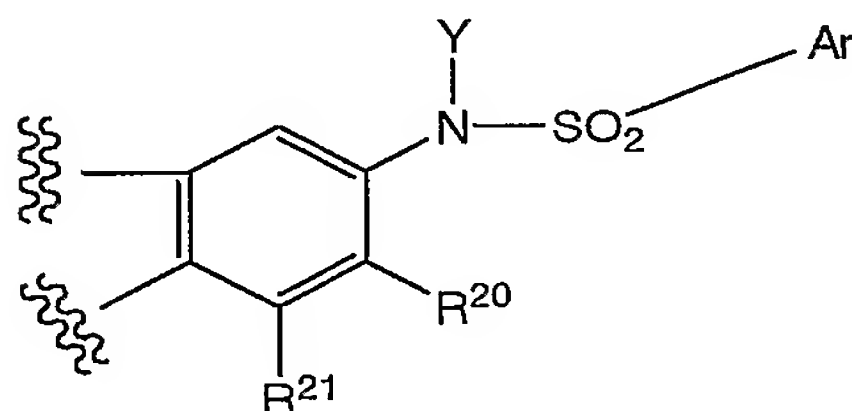


- 5 (y は 1 ～ 3 の整数 ; m、p、Y および A r は前記と同意義) で示される基、
式：



(m、y および A r は前記と同意義) で示される基、

または式：



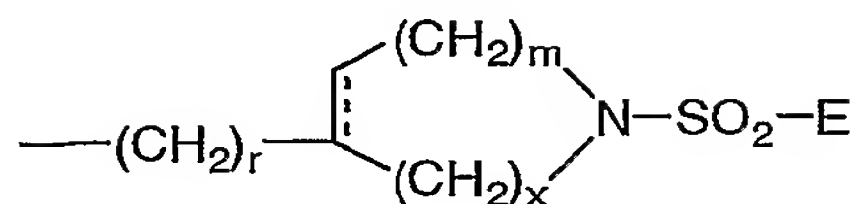
10

(Y および A r は請求の範囲第 1 項と同意義であり ; R²⁰ および R²¹ は水素である) で示される基である請求の範囲第 1 項記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

3. Y がアルキル、アルケニル、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいアラルキルである請求の範囲第 1 項または第 2 項記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

4. R³ が式： $-(CH_2)_n-N(-Y)-SO_2-Ar$ (式中、n は 2 または 3 ; Y は水素、アルキル、アルケニル、またはアラルキル ; および A r は請求の範囲第 1 項と同意義) で示される基である請求の範囲第 2 項記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

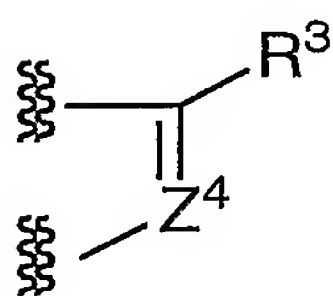
5. R^3 が式 :



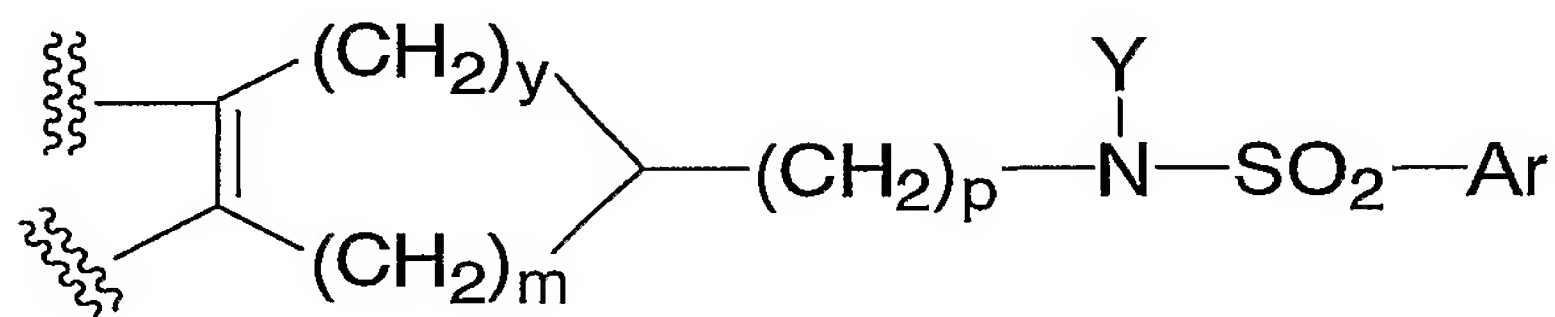
(式中、 m は 1 ; r は 0 ; x は 2 ; 破線は結合の不存在を表わし ; および E は請求の範囲第 2 項と同意義) で示される基である請求の範囲第 2 項に記載の化合物、

5 そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

6. 式 :

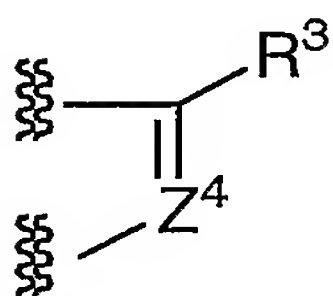


で示される基が式 :



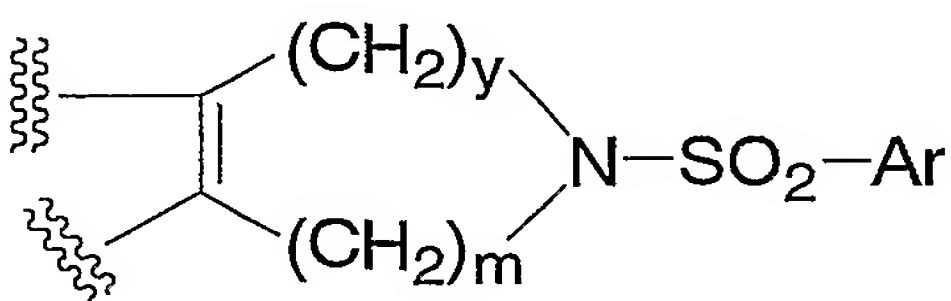
10 (m は 2 ; p は 0 ; y は 1 ; Y は水素、アルキル、アルケニルまたはアラルキル ; および Ar は請求の範囲第 1 項と同意義) で示される基である請求の範囲第 2 項に記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

7. 式 :



15

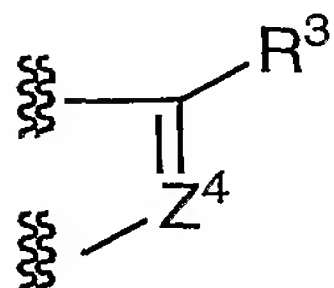
で示される基が式 :



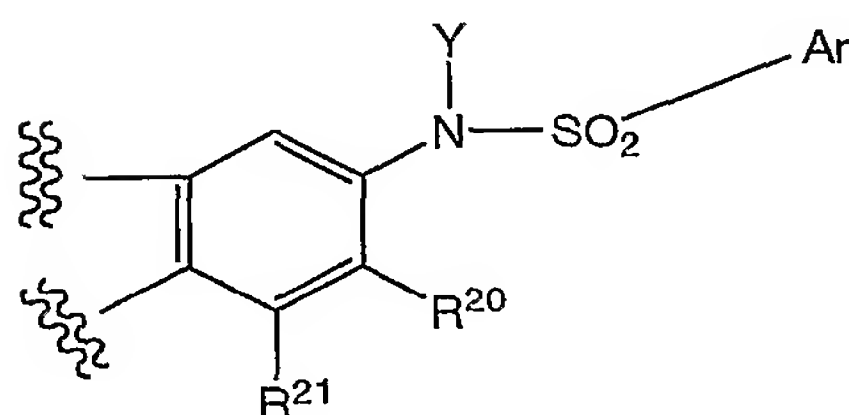
(m は 1 または 2 ; y は 1 または 2 ; および Ar は請求の範囲第 2 項と同意義)

で示される基である請求の範囲第2項に記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

8. 式：



5 で示される基が式：



(Yは水素、アルキル、アルケニルまたはアラルキル；およびR²⁰、R²¹およびArは請求の範囲第1項と同意義)で示される基である請求の範囲第2項記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

9. R¹がカルボキシである請求の範囲第1項～第8項のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

10. R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷がそれぞれ独立して水素、ハロゲン、アルキル、アルケニル、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいアラルキルである請求の範囲第1項～第9項のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

11. R²が水素またはアルキルである請求の範囲第1項～第10項のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物。

12. 請求の範囲第1項～第11項のいずれかに記載の化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩またはそれらの溶媒和物を有効成分として含有する医薬組成物。

1 3 . C R T H 2 受容体拮抗剤として使用する請求の範囲第 1 2 項記載の医薬組成物。

1 4 . 請求の範囲第 1 項に記載の化合物を投与することを特徴とする C R T H 2 受容体に関する疾患の治療方法。

5 1 5 . C R T H 2 受容体に関する疾患の治療剤を製造するための、請求の範囲第 1 項に記載の化合物の使用。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/06076

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D209/14, 209/94, 209/86, 209/88, 401/04, 403/04,
409/12, 409/14, 471/04, 209/16, 403/06, 401/06, 401/14,
487/04, 231/56, 495/04, A61K31/403, 31/405, 31/4439, 31/454,

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D209/14, 209/94, 209/86, 209/88, 401/04, 403/04,
409/12, 409/14, 471/04, 209/16, 403/06, 401/06, 401/14,
487/04, 231/56, 495/04, A61K31/403, 31/405, 31/4439, 31/454,

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAPLUS, REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 473024 A1 (BAYER A.G.), 04 March, 1992 (04.03.92),	1-4, 6, 9-13, 15
A	& DE 4027278 A & JP 4-257578 A & US 5223517 A	5, 7, 8
Y	EP 451634 A2 (BAYER A.G.), 16 October, 1991 (16.10.91), & AU 9174252 A & CA 2039873 A & PT 97280 A & ZA 9102609 A & JP 4-234846 A & NZ 237709 A & US 5204374 A & TW 221995 A & IL 97795 A	1-4, 6, 9-13, 15

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:
"A" document defining the general state of the art which is not
considered to be of particular relevance
"E" earlier document but published on or after the international filing
date
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is
cited to establish the publication date of another citation or other
special reason (as specified)
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other
means
"P" document published prior to the international filing date but later
than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or
priority date and not in conflict with the application but cited to
understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be
considered novel or cannot be considered to involve an inventive
step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be
considered to involve an inventive step when the document is
combined with one or more other such documents, such
combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
22 July, 2003 (22.07.03)

Date of mailing of the international search report
12 August, 2003 (12.08.03)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/06076

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 425906 A2 (BAYER A.G.), 08 May, 1991 (08.05.91), & NO 9004487 A & CA 2028621 A & FI 9005294 A & AU 9063848 A & US 5039670 A & PT 95728 A & ZA 9008637 A & CN 1051354 A & US 5096897 A & US 5374647 A & PH 27484 A	1-4, 6, 9-13, 15
Y	JP 11-322600 A (BAYER YAKUHIIN KABUSHIKI KAISHA), 24 November, 1999 (24.11.99), (Family: none)	1-4, 6, 9-13, 15
Y	JP 11-116477 A (BAYER YAKUHIIN KABUSHIKI KAISHA), 27 April, 1999 (27.04.99), (Family: none)	1-4, 6, 9-13, 15
Y	JP 8-175991 A (BAYER YAKUHIIN KABUSHIKI KAISHA), 09 July, 1996 (09.07.96), (Family: none)	1-4, 6, 9-13, 15
Y	Chemical Abstracts, Vol.117, abs.No.19896	1-4, 6, 9-13, 15
A	JP 11-343279 A (SHIONOGI & CO., LTD.), 14 December, 1999 (14.12.99), (Family: none)	1
A	WO 01/14882 A (BML INC.), 01 March, 2001 (01.03.01), & EP 1211513 A1 & NO 2002000837 A	13, 15
A	EP 1170594 A2 (PFIZER PROD. INC.), 09 January, 2002 (09.01.02), & US 2002/022218 A1 & JP 2002-98702 A	13, 15

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/06076

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 14

because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

The invention as set forth in claim 14 pertains to method for treatment of the human body by therapy.

2. ☐ Claims Nos.:

because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. ☐ Claims Nos.:

because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/06076

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER (International Patent Classification (IPC))

Int.Cl⁷ 31/437, 31/4709, 31/407, A61P11/06, 37/08, 43/00

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC)

Continuation of B. FIELDS SEARCHED

Minimum Documentation Searched (International Patent Classification (IPC))

Int.Cl⁷ 31/437, 31/4709, 31/407, A61P11/06, 37/08, 43/00

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))
 Int. Cl⁷ C07D209/14, 209/94, 209/86, 209/88, 401/04, 403/04, 409/12, 409/14, 471/04, 209/16, 403/06, 401/06, 401/14, 487/04, 231/56, 495/04, A61K31/403, 31/405, 31/4439, 31/454, 31/437, 31/4709, 31/407, A61P11/06, 37/08, 43/00

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D209/14, 209/94, 209/86, 209/88, 401/04, 403/04, 409/12, 409/14, 471/04, 209/16, 403/06, 401/06, 401/14, 487/04, 231/56, 495/04, A61K31/403, 31/405, 31/4439, 31/454, 31/437, 31/4709, 31/407, A61P11/06, 37/08, 43/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)
 CAPLUS, REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	EP 473024 A1 (BAYER A. G.) 1992. 03. 04 & DE 4027278 A & JP 4-257578 A & US 5223517 A	1-4, 6, 9-13, 15
A		5, 7, 8
Y	EP 451634 A2 (BAYER A. G.) 1991. 10. 16 & AU 9174252 A & CA 2039873 A & PT 97280 A & ZA 9102609 A & JP 4-234846 A & NZ 237709 A & US 5204374 A & TW 221995 A & IL 97795 A	1-4, 6, 9-13, 15

☒ C欄の続きにも文献が列举されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
 「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
 「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
 「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
 「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
 「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
 「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
 「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

22. 07. 03

国際調査報告の発送日

12.08.03

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

富永 保

4 P

9159

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	EP 425906 A2 (BAYER A. G.) 1991. 05. 08 & NO 9004487 A & CA 2028621 A & FI 9005294 A & AU 9063848 A & US 5039670 A & PT 95728 A & ZA 9008637 A & CN 1051354 A & US 5096897 A & US 5374647 A & PH 27484 A	1-4, 6, 9-13, 15
Y	JP 11-322600 A (BAYER YAKUHHIN K. K.) 1999. 11. 24 (ファミリーなし)	1-4, 6, 9-13, 15
Y	JP 11-116477 A (BAYER YAKUHHIN K. K.) 1999. 04. 27 (ファミリーなし)	1-4, 6, 9-13, 15
Y	JP 8-175991 A (BAYER YAKUHHIN K. K.) 1996. 07. 09 (ファミリーなし)	1-4, 6, 9-13, 15
Y	Chemical Abstracts, vol. 117, abs. no. 19896	1-4, 6, 9-13, 15
A	JP 11-343279 (SHIONOGI & CO., LTD.) 1999. 12. 14 (ファミリーなし)	1
A	WO 01/14882 A1 (BML INC.) 2001. 03. 01 & EP 1211513 A1 & NO 2002000837 A	13, 15
A	EP 1170594 A2 (PFIZER PROD. INC.) 2002. 01. 09 & US 2002/022218 A1 & JP 2002-98702 A	13, 15

法第8条第3項（PCT17条(2)(a)）の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

- 第Ⅱ欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1 ページの3 の続き)

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。

☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。

改訂版

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2003 年 11 月 27 日 (27.11.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2003/097598 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07D 209/14,
209/94, 209/86, 209/88, 401/04, 403/04, 409/12, 409/14,
471/04, 209/16, 403/06, 401/06, 401/14, 487/04, 231/56,
495/04, A61K 31/403, 31/405, 31/4439, 31/454, 31/437,
31/4709, 31/407, A61P 11/06, 37/08, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/006076

(22) 国際出願日: 2003 年 5 月 15 日 (15.05.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2002-142126 2002 年 5 月 16 日 (16.05.2002) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 塩野
義製薬株式会社 (SHIONOGI & CO., LTD.) [JP/JP]; 〒
541-0045 大阪府 大阪市中央区 道修町 3 丁目 1 番 8 号
Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 谷本 憲彦 (TAN-
IMOTO, Norihiko) [JP/JP]; 〒553-0002 大阪府 大阪市
福島区 鷺洲 5 丁目 1 2 番 4 号 塩野義製薬株式会
社内 Osaka (JP). 平松 義春 (HIRAMATSU, Yoshiharu)
[JP/JP]; 〒553-0002 大阪府 大阪市福島区 鷺洲 5 丁目
1 2 番 4 号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 光森
進 (MITSUMORI, Susumu) [JP/JP]; 〒553-0002 大阪府
大阪市福島区 鷺洲 5 丁目 1 2 番 4 号 塩野義製薬株
式会社内 Osaka (JP). 稲垣 雅尚 (INAGAKI, Masanao)
[JP/JP]; 〒553-0002 大阪府 大阪市福島区 鷺洲 5 丁目
1 2 番 4 号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 山内 秀晃, 外(YAMAUCHI, Hideaki et al.);
〒553-0002 大阪府 大阪市福島区 鷺洲 5 丁目 1 2 番
4 号 塩野義製薬株式会社 知的財産部 Osaka (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO,
NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL,
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU,
ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM,
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許
(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,
GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),
OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

(88) 改訂された国際調査報告書の公開日: 2004 年 7 月 8 日

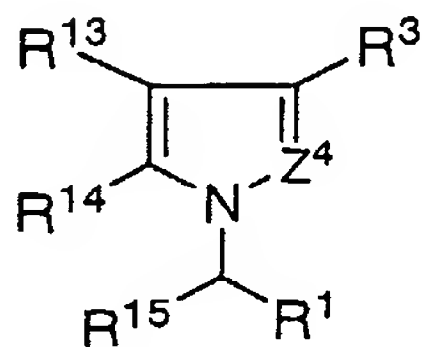
(15) 訂正情報:

PCTガゼット セクションIIの No.28/2004 (2004 年 7 月
8 日)を参照

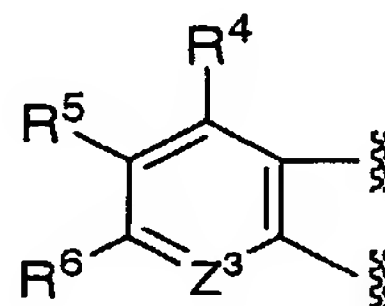
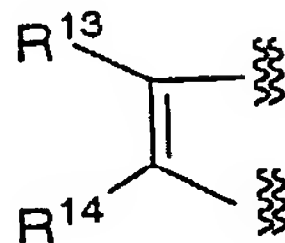
2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: COMPOUND EXHIBITING PGD 2 RECEPTOR ANTAGONISM

(54) 発明の名称: P G D 2 受容体拮抗作用を有する化合物



(I)



(57) Abstract: A compound exhibiting CRTH 2 receptor antagonism, represented by the following formula (I), which compound is useful in the treatment of allergosis with which the association of eosinocytes is presumed, etc.: (I) wherein the group represented by the formula: (a) is a group of the formula: (b) or the like; R¹ represents carboxyl, etc.; R³ represents a group of the formula -(CH₂)_n-N(-Y)SO₂-Ar, etc.; and the other substituents are as defined in claim 1.

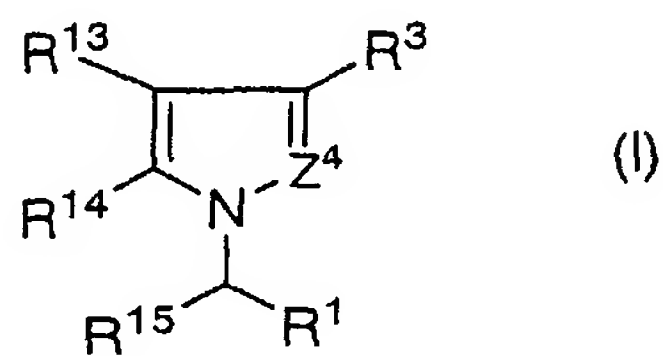
[続葉有]

WO 2003/097598 A1

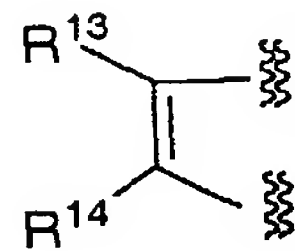


(57) 要約:

C R T H 2 受容体拮抗作用を有する下記式 (I) で表される新規化合物を見出した。該化合物は好酸球が関与していると考えられるアレルギー疾患等に有用である。

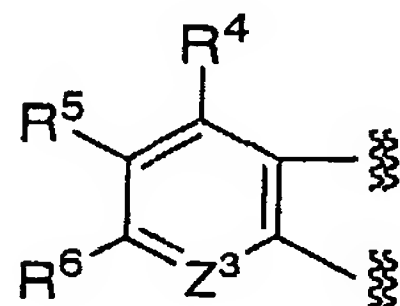


(式中、
式：



で示される基は

式：



等を、R¹は、カルボキシ等を、R³は

式：—(CH₂)_n—N(—Y)SO₂—Ar等を

その他の置換基は請求の範囲 1 に記載された通りを示す。)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/06076

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D209/14, 209/94, 209/86, 209/88, 401/04, 403/04,
409/12, 409/14, 471/04, 209/16, 403/06, 401/06, 401/14,
487/04, 231/56, 495/04, A61K31/403, 31/405, 31/4439, 31/454,

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D209/14, 209/94, 209/86, 209/88, 401/04, 403/04,
409/12, 409/14, 471/04, 209/16, 403/06, 401/06, 401/14,
487/04, 231/56, 495/04, A61K31/403, 31/405, 31/4439, 31/454,

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS, REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 473024 A1 (BAYER A.G.), 04 March, 1992 (04.03.92),	1-4, 6, 9-13, 15
A	& DE 4027278 A & JP 4-257578 A & US 5223517 A	5, 7, 8
Y	EP 451634 A2 (BAYER A.G.), 16 October, 1991 (16.10.91), & AU 9174252 A & CA 2039873 A & PT 97280 A & ZA 9102609 A & JP 4-234846 A & NZ 237709 A & US 5204374 A & TW 221995 A & IL 97795 A	1-4, 6, 9-13, 15



Further documents are listed in the continuation of Box C.



See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T"

later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X"

document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y"

document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&"

document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

22 July, 2003 (22.07.03)

Date of mailing of the international search report

12 August, 2003 (12.08.03)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/06076

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 425906 A2 (BAYER A.G.), 08 May, 1991 (08.05.91), & NO 9004487 A & CA 2028621 A & FI 9005294 A & AU 9063848 A & US 5039670 A & PT 95728 A & ZA 9008637 A & CN 1051354 A & US 5096897 A & US 5374647 A & PH 27484 A	1-4, 6, 9-13, 15
Y	JP 11-322600 A (BAYER YAKUHIN KABUSHIKI KAISHA), 24 November, 1999 (24.11.99), (Family: none)	1-4, 6, 9-13, 15
Y	JP 11-116477 A (BAYER YAKUHIN KABUSHIKI KAISHA), 27 April, 1999 (27.04.99), (Family: none)	1-4, 6, 9-13, 15
Y	JP 8-175991 A (BAYER YAKUHIN KABUSHIKI KAISHA), 09 July, 1996 (09.07.96), (Family: none)	1-4, 6, 9-13, 15
Y	Chemical Abstracts, Vol.117, abs.No.19896	1-4, 6, 9-13, 15
A	JP 11-343279 A (SHIONOGI & CO., LTD.), 14 December, 1999 (14.12.99), (Family: none)	1
A	WO 01/14882 A (BML INC.), 01 March, 2001 (01.03.01), & EP 1211513 A1 & NO 2002000837 A	13, 15
A	EP 1170594 A2 (PFIZER PROD. INC.), 09 January, 2002 (09.01.02), & US 2002/022218 A1 & JP 2002-98702 A	13, 15

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/06076

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 14

because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

The invention as set forth in claim 14 pertains to method for treatment of the human body by therapy.

2. ☐ Claims Nos.:

because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. ☐ Claims Nos.:

because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

☐

The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

☐

No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/06076

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER (International Patent Classification (IPC))

Int.Cl⁷ 31/437, 31/4709, 31/407, A61P11/06, 37/08, 43/00

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC)

Continuation of B. FIELDS SEARCHED

Minimum Documentation Searched (International Patent Classification (IPC))

Int.Cl⁷ 31/437, 31/4709, 31/407, A61P11/06, 37/08, 43/00

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC)) Int. Cl ⁷ C07D209/14, 209/94, 209/86, 209/88, 401/04, 403/04, 409/12, 409/14, 471/04, 209/16, 403/06, 401/06, 401/14, 487/04, 231/56, 495/04, A61K31/403, 31/405, 31/4439, 31/454, 31/437, 31/4709, 31/407, A61P11/06, 37/08, 43/00		
B. 調査を行った分野 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC)) Int. Cl ⁷ C07D209/14, 209/94, 209/86, 209/88, 401/04, 403/04, 409/12, 409/14, 471/04, 209/16, 403/06, 401/06, 401/14, 487/04, 231/56, 495/04, A61K31/403, 31/405, 31/4439, 31/454, 31/437, 31/4709, 31/407, A61P11/06, 37/08, 43/00		
最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの		
国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語) CAPLUS, REGISTRY (STN)		
C. 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y A Y	EP 473024 A1 (BAYER A. G.) 1992. 03. 04 & DE 4027278 A & JP 4-257578 A & US 5223517 A EP 451634 A2 (BAYER A. G.) 1991. 10. 16 & AU 9174252 A & CA 2039873 A & PT 97280 A & ZA 9102609 A & JP 4-234846 A & NZ 237709 A & US 5204374 A & TW 221995 A & IL 97795 A	1-4, 6, 9-13, 15 5, 7, 8 1-4, 6, 9-13, 15
<input checked="" type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。		
* 引用文献のカテゴリー 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願 の日の後に公表された文献 「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」 同一パテントファミリー文献		
国際調査を完了した日 22. 07. 03	国際調査報告の発送日 12.08.03	
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/J P) 郵便番号 100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 富永 保 電話番号 03-3581-1101 内線 3490	4 P 9159 印

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	EP 425906 A2 (BAYER A. G.) 1991. 05. 08 & NO 9004487 A & CA 2028621 A & FI 9005294 A & AU 9063848 A & US 5039670 A & PT 95728 A & ZA 9008637 A & CN 1051354 A & US 5096897 A & US 5374647 A & PH 27484 A	1-4, 6, 9-13, 15
Y	JP 11-322600 A (BAYER YAKUHIIN K. K.) 1999. 11. 24 (ファミリーなし)	1-4, 6, 9-13, 15
Y	JP 11-116477 A (BAYER YAKUHIIN K. K.) 1999. 04. 27 (ファミリーなし)	1-4, 6, 9-13, 15
Y	JP 8-175991 A (BAYER YAKUHIIN K. K.) 1996. 07. 09 (ファミリーなし)	1-4, 6, 9-13, 15
Y	Chemical Abstracts, vol. 117, abs. no. 19896	1-4, 6, 9-13, 15
A	JP 11-343279 A (SHIONOGI & CO., LTD.) 1999. 12. 14 (ファミリーなし)	1
A	WO 01/14882 A1 (BML INC.) 2001. 03. 01 & EP 1211513 A1 & NO 2002000837 A	13, 15
A	EP 1170594 A2 (PFIZER PROD. INC.) 2002. 01. 09 & US 2002/022218 A1 & JP 2002-98702 A	13, 15

第Ⅰ欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見（第1ページの2の続き）

法第8条第3項（PCT17条(2)(a)）の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☒ 請求の範囲 14 は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。つまり、
請求の範囲14に記載された発明は、人体の治療による処置方法に該当する。
2. ☐ 請求の範囲 _____ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. ☐ 請求の範囲 _____ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第Ⅱ欄 発明の単一性が欠如しているときの意見（第1ページの3の続き）

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるところこの国際調査機関は認めた。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。